# (9 日本国特許庁 (JP)

# **①特許出願公開**

# 0公開特許公報(A)

昭55—11600

(1) Int. Cl.<sup>3</sup>
 C 07 D 501/22
 501/34
 501/36
 A 61 K 31/545

識別記号

ADZ

庁内整理番号 6365--4C 6365--4C 6365--4C 63公開 昭和55年(1980)1月26日

発明の数 9

発明の数 9 審査請求 未請求

. (全71 頁)

砂セフエム化合物、その塩類、それらの製造方法およびそれらを主成分とする細菌感染症予防・治療剤

②特 B

顧 昭54-87941

顧 昭54(1979)7月10日

優先権主張 ②1978年7月10日③イギリス (GB)①29357/78

⑩発 明 者 寺地務

大阪府豊能郡豊能町光風台6-20-6

**加架 明 者 坂根和夫** 

尼崎市園田町 6 --60--5

の発明者後藤二郎

吹田市樫切山21A-401 の出 顕 人 藤沢峯品工業株式会社

大阪市東区道修町4丁目3番地

の代理 人 弁理士 青木高

t 発明の名前

セフェル化合物、その種類、それらの製造方法 およびそれらを主要分とする動物感染度予防・治 除剤

2. 特許額末の範囲

(1) 一般型



(文章 12 セブミン文は保留されたフェン、 14 は低級アルキル、 25 は水果又は低酸デルキル、 26 は水果又は低酸デルキル。 15 は水煮、アシルボルン (成戦) ブッルル・アジルドメ (低級) ブッルル・フジルドメ (低級) ブルル・フェルドメ (低級) ブルル・ス・ス・3 社のルボルン文は保護されたカルボルシャナルである。 2 社のルボルン文は保護されたカルボルシャナルである。

で示されるモフェム化会物シェびその事業。 (2) gi で示される最か gi で

る神奈線承の韓国ポー項記載の化合物のレン兵性 体およびその複駁。

(内) ま<sup>5</sup> が水素である特許前次の範囲等2項記載 (の化各輪かよびでの準備。 (内) ま<sup>6</sup> がアミノ又はジ(低級)アルキボブミノ

で最終された低級デルギリデンアミノ、 2 が水 帯である特許需求の信用部を項記載の化合物かよ びその複類。

(8) こか がカルボキシ支はニトロで関係されていてもまいアリール(任義)アルコキシカルボニル でもまいアリール(任義)アルコキシカルボニル である特許線水の福田郎・項記載の化合物シよび アルロ音楽。

(4) - 15 がカルボキレ又はエトロで最適されたフ エエル (4) 後後) アルコキレガルボニルである特許 勝次の親居なら 東記載の化を値かとびその取収。 (7) 「15」がアミプスセンス・レンス・レンス・ コンプ、ボールがアンス・エルルではパンテロビル。 E<sup>5</sup> がカルボキシ又は4 - ニトロペンジルオキシ カルボニルである特許級求の範囲第6項記載の化 余価かよびその監理。

(8) 7-(2-メトキレイミノ・2・(5-アミノ・1,24・サアリアゾール・3・イル)アセトアミアコラー・モアニトリー3・イルリアセトアミアリー3・モアニム・4・カルボン酸(レンスサインの表)であるかかが、であるかが高端の心の表してバイの発展。

(9) 7-(2-1)キャレイミノ-2-(6-アミノ・1.2.4-テンリアンール・3-イル)アセトアミドリー5-モアニル・4-カルボン乗の4-エトロペンジルエステル(レン典性体)である特許数の回転を7項記載の化合物。

(10) ア・C 2・メトキレイミノ・2・(5・ 4 (ボーくスペ・アンアンア・ス・ス・イル) アミノ ) ・ 1、2.4・アアンアソール・3・イル) アモトア ミドリー5・セアニム・4・カルボン酸の4・ニトロペンリルエステル(レン異性外)である特許 級次の関係表で現代的では、

(11) 7 - [ 2 - x + 4 > 4 3 / - 2 - ( 8 - 7

特別 切55-11600(2) ミノ・124-テフタアゾール・5・イル)アセ トアミド)・3・セフエム・4・カルボン数(レ と責性化)である特許別求の問題が7項形象の化 かねとだけその展標。

(12) 7 - [2 - エトキレイミノ - 2 - (5 - 7 ミノ - (24 - キアジアゾール - 5 - イル)アセトアミド) - 5 - マアエム - 4 - カルボン原の4 - エトロペンジルエステル(シン異性体)である 特許請求の報酬者 7 項記載の化合物。

(18) ア・じューインプロボキレイミ・・ュー (3 - アミノ・じュューナアリアリール・3・イ ル)アセトアミドリ・5 - セフエム・4 - カルボ シ教(レン最低水)である特許様才の軌間外7 現 記載の化合物かよび先の複類。

(44) 7、C 2・4 ソプロボやレイミノ・3・ (5・アミノ・し24・サアジアゾール・3・4 ル) アセトアミド3・5・モアエム・4・カルボ ン数の4・エトロペンジルエステル(セン製技作) である仲介讃求の範囲等7 項記載の化合物。

(15) 取 がアミノ、取 がアシルオキシ(任根)

アルキル、18<sup>5</sup> がカルボキシである特許請求の範 勝第 5 項記載の化合物シングその複製。

(16) R<sup>4</sup> が低級アルカノイルオキシ(低級)ア ルキルである特許請求の報酬第1 5 項記載の化合 協かよびその監察。

(17) 3<sup>4</sup> が低級アルカノイルオキレメテルである特許請求の範囲第16項記載の化合物およびその物面。

(18) 3<sup>2</sup> がメテル、エテル又はインプロビル、 3<sup>4</sup> がアセトテレメテルである特許額求の範囲等 1 7 項配収の化合物かよびその框架。

(19) ァ・〔2 - メトキレイミノ・2 - (5 - ア ミノ・1.2 4 ・チアジアゾール・5 - イル)アセ トアミド)セッアの形ポラン酸(レン異性体)で もの特許療式の範疇所15項記載の化合物かよび その整備。

(20) ァーC 2-エトキレイミノー2 - (5-ア ミノー 1.2.4 - ナアジアパーペー5 - イル)アセ トアミド)セフアロスボラン酸(レン具性休)で ある特許様次の戦闘第18項記載の化合物かよび よの事業。

(21) 7 - C 2 - イソプロポキレイミノー 2 -(5 - アミノ・1.24 - ナアジアソール・5 - イル)アセトアミドラセアアロスボラン酸(レン員 低水)でもと終昇離太の範囲無 1 8 系記載の化会 物およびその駆威。

(22) 14 がカルバモイルオキシ(低級)アルキルである特許額次の信用券 1 5 項配板の化合物シよびその集製。

アルヤル、JE がカルボヤンである特許値求の範囲第58項記載の化合物かよびその監察。

(25) 2<sup>4</sup>。が低級アルカノイルテオ(低級)アル キルである特許額次の範囲第24項記載の化合物 かよびその名祭。 (26) R4 が低級アルカノイルテオメテルである

始許能力の能限数25項記載の化み能かよびその ---(27) 7 - 1 2 - 4 b # \$ 4 5 4 - 2 - ( 5 - 7

1/-124-+TUTY-w-8-4w)T\* トアミドリ・3 - アセチルチオノテル・3 - セフ スム・4・カルボン酸(シン県鉄体)である特許 勝才の範囲第26項記載の化合薬かよびその拡張。 (28) x4 が適当な保険器で保険されていてもよ い崔素豊チオ(低級)アルキル、25 がカルボキ

シである特許額求の範囲第8項記載の化合物かよ びその無限。

(29) m゚ がアミノ、低級アルカノイルアミノ叉 はホスホノアミノ、 14 がナアジアソリルチオ (低級)アルサル、チアソリルチオ(低級)アル キル、テトラゾリルテオ(丘根)アルキル、トリ アゾリルチオ(任無)アルキル、ピラジニルチオ ( 長前 ) アルキル、テトラブロビミダジニルテオ (がお) アルタルマけひと ドロトリアゾロビリギ

特期 昭55-11600 (3) ジェルナオ ( 長田 ) アルキルで、これらのあるは 1又は2の任果アルテル、任根アルケニル、ヒド ロキン(仮数)アルキル、アミノ(仮典)アルキ ル、毎年されナアミノ(公参)アルカル、任务で ルケニルテオ、任無アルコキシ(佐納)アルキル、 低級アルキルチオ(低級)アルキル、アシルアミ ノ(伝表)アルキル、アシル(仮扱)アルキル、 カルボキシ、エステル化されたカルボキシ、スル あく任務)アルキル、ジ(任義)アルキルアミノ (低級)アルキル、カルポキシ(低級)アルキル、 てミノ、 おかポキシ(佐藤)アルキルチオ、オキ ソ、ハロ(佐根)アルキル又は佐根アルキルアミ ノナ製機されていてもよい他形態度の範囲第28 **薬配性の化合物かよびその推奨。** 

(80) R<sup>1</sup> ポアミノ又はホスホノアミノ、R<sup>4</sup> が †他の低級アルキル、ヒドロキン(低級)アルキ ル、アミノ(仮数)ブルキル、低級アルコキシカ ルポニルアミノ(佐根)アルキル、佐根アルケニ ルチオ、亜級アルコキシ(低級)アルキル、低級 アルカンスルホニルブミノ(低量)アルキル、低

ぬアルカンスルホニル(佐穀)アルキル、カルボ キシ、仮鉄アルコキシカルポニル、アミノ、カル ボキシ(仏装)アルキルチオ、ハロ(仏装)アル キル、任義アルキルアミノもしくは係根アルキル チオ(長折)アルキルで収換されていてもよいチ アリアゾリルチナノテルナある動作機会の無関係 29項記載の化合物かよびその収集。

(51) g4 で示されるチアジアゾリルテオメテル がしる4・チアジアゾリルテオメテル又は1,24 - チアジアプリルテオメチルである特許勝求の概 **開第50項記載の化合物かよびその収集。** 

(82) R1 NTS/, R2 N/TN, ETN, T ロビル又はイソプロビルで、14 が1個のメナル、 プロビル、ヒドロキシグテル、ヒドロキシエテル、 アミノメテル、アミノエテル、佑ろ根プトキレカ ルポニルアミノノテル、アリルテオ、メトキシノ ナル、メナルナオメナル、メンルアミノメチル、 メンルメテル、アミノ、カルボタンメテルテオ、 トリフルオロメチルもしく仕メチルアミノで最終 されていてもよい 5 & 4 - チアジアゾリルチオメ

ナル又はメテル、アリルテオ、カルボキシもしく はメトキレカルポニルで置換された 1.2.4 - テア ジアゾリルチオメテルである特許請求の復居祭 5 1 展記曲の化会施かよびその集構。

(55) フ・[2・メトキシイミノ・2・(5・ア \* / - 1 2 4 - # 7 5 7 7 - # - 5 - 4 # 1 7 # トナミドリーカー ( もん4・サアジアゾール・2 · 1 ル ) チオメチル・5 - セフエム・4 - カルボ ン僚(シン英性体)である特許療法の範囲第32 原記載の化会をおよびその事業。

(84) 7 - [ 2 - エトキシイミノ・2 - ( 5 - ア 1/- 124 - FTFTY-W-3-4W)TT トナミドン・8~(ち६4・ナブジアゾール・2 ン酸(シン具性休)である特別勝収の範囲第52 変形像の化会物かよびその集集。

(55) フ・L2・プロポキシイミノ・2・(5-アミノ・ミダイ・テアジアソール・8・イル)ア セトアミドン・る・(しる4・チアジアゾール・ 2-4~)++++~-8-47=4-4-2~ ボン爾(シン集件体)である特許値点の銀貨車を2 **楽記載の化合物かよびその複数。** 

(SA) 7 - 5 9 - 4 7 7 m 4 m 4 4 4 4 - 9 - 1 ( 5 - アミノ・1,2,4 - ナアジアゾール・5 - 4 ル)アセトアミド)・5・( しら4・チアジァソ - カルボン巻(レン具件体)である熱杵能力の他

闘略 5 2 項記載の化合物およびその集製。

(57) 7 - [ 2 - J | ++ > 4.3 J - 2 - C5 - 7 ミノ・1,24・テアジアゾール・5・イル)アセ トアミドリーろ・( 5・メナル・しふ4・チブジ フゾール・2 - イル) ナオメチル・5 - セフェム

・4・カルボン数(シン具体体)である特件請求

トアミド)・5・(5・プロビル・134・チア ジアソール・フ・イルトチャノチル・ス・マフェ

の範囲第52項記載の化合物かよびその塩類。 (38) 7-[2-メトキシイミノ・2・(5-ア ミノ・ しこ4・テアジアゾール・5・イル)ナモ

A・4・カルボン酸(シン具性休)である特許額 水の範囲第52項配象の化合物かよびその複響。

(59) 7 · [2 · 1 ) \* V 4 5 1 · 2 · [5 · 7 ミノ・リスリ・チナジアゾール・ミ・イル)ナセ 173 F3 - 5 - ( 5 - E FD + V / + N - 184 ・テアジアゾール・2・イル)チオメテル・5・ マフエム・4~カルボン酸(シン具性休)である 特許業求の範囲第32項記載の化み始かとびその ...

(40) 7 · [2 · / トキシイミノ · 2 · (5 - ア ミノ・ 5.2.4・ナブジアソール・ミ・イル)アセ FTEF) - 8 - [8 - (2 - E FE + V × FN) - 1.54 - +TUTY-A - 2 - 1 AND ++ 14 ルーガーセフエム・4・カルボン酸(シン具性体) である特許膜水の範囲第52項記載の化合物をよ びその単葉。

(41) 7 - [2-11444 21-2-(5-7 5/ · 124 · チアジアゾール · 5 · イル) アセ トアミドリ・ル・(カ・アミノンナル・エエム・ ナアジアゾール・2・イル)ナオノナル・5・セ フエム・4 - カルボン酸(シン英佐休)である特

計算水の集団信 5 2 変配性の化み始か 1 パチの性

(42) 7 - (2 - x > 4 × 4 2 / - 2 - (5 - 7 ミノ・リス4・テアジアゾール・5・イル)アセ トアミドコース・(ラ・アミノメチャーもる4-ナアジアゾール・2・イル ) ナオノナル・3・セ フエム・4・カルボン酸(シン異性休)である特 計画水の低速等32項形成の化会物かよびその単 概。

(45) ,7 - C 2 - 177084V.1 27 - 2 -(5-73/-124-+TDTY-N-3-4 ル)アセトアミドリー 8.- (5 - アミノメチル・ しら4・チアジアゾール・2・イル)チオメチル - 5 - セフエム・4 - カルボン酸(シン美性体) てある特許満求の処器部32項配金の化会施かり びその集構。

(44) 7 - [ 2 - / havi = /- 2 - (:5 - 7 ミノ・1.2.4・テアジアソール・3・イル)アセ トアミドリ・カ・(5・(2・アミノエナル)・ しる4・テアジアソール・2・イルンテオノテル - 3 - セフエム・4 - カルボン酸(シン具性体) である特許確定の範囲第32項記載の化会験がよ 16.2-O-11

(45) 7 - C2 - x > + + × 4 2 / - 2 - (5 - 7 ミノ・ 124・サブジアゾール・5・イル)エセ トアミドリーカー(カ・アリルテオ・ルム4・チ ア.レアソール・2・イル)ナオノチル・5・セフ エム・4・カルボン酸(シン異性体)である特許 請求の職務第52項記載の化合物かよびその無償。 (46) 7-C2-1+++12-2-(5-7 ミノ・しこ4・チァジアゾール・8・イル)アセ トナミドコー8・(5・メトキンノナル・154 - ナアジアゾール・2・イル)ナオノナル・5・ セアエム:4・カルポン酸(シン具性体)である 特許薪求の範囲第 8 2 項記載の化合物およびその E CL.

(47) 7 - [ 2 - 1 | + + v + 2 / - 2 - [ 5 - 7 ミノ・ しえ4・テナジアゾール・3・イル) アセ

トナミドラ・8-(5-メテルテオメテル- 1.5.4 ュオブジアソール・2・イル)チオノテル・3・ セフエム・4・カルポン酸(シン具性体)である

# 特期 昭55-- 11600 (5)

特許農水の範囲第32項記載の化合物およびその 塩類。

(48) 7・〔2・4)キャイミノ・2・〔5・7 ミノ・1、2.4・サアリアゾール・5・4ル)でも トアミドリ・5・〔5・4)テンルルマンテミドノ テル・1、3.4・サアリアゾール・2・4ルリーテ オノテル・5・セフエム・4・カルボン教〔レン 異性界)である特許商業の報酬第32項記載の化 かかり打ちの問題。

(49) 7・〔2 - ノトルレイミノ・2 - (5・ア ミノ・1、2.4 - サアリアブール・3 - イル)アセ トアミ ア〕 - 3 - (5 - ノレルノサル・ 3.4 -ナアリアブール・2 - イル)サオノサル・3 - エ フエム・4 - タルボン酸(レン臭性杯)でもる特 耐器水の電器者 5 2 現記載の化の物かよびその塩

(50) 7 - (2 - メトキレイミノ - 2 - (8 - 7 ミノ - 1,24 - サアロアソール - 8 - 4ル) アセ トアミドリ - 5 - (5 - アミノ - 1,54 - サアロ アソール - 2 - 4ル) サオメテル - 5 - セフエム - 4 - カルボン紋(シン異性体)である特許額求 の範囲第32項記憶の化合物かよびその無償。

(51) 7・(2・1トキレイミノ・2・(5・7 ミノ・12.4・プロブゾール・5・イル)アセ トプミドリ・5・(5・カルボヤレノナルナホ・ 15.4・プアジアジール・2・イル)マネリテル・ ・5・セフエム・4・カルボン酸(レン異性体) である仲野雑末の発酵店32項記載の化合物かよ ばその監解。

(33) フ・C 2・メトキレイミノ・2・(5・ア ミノ・ L 2・イ・サアリアブール・3・イル) アセ トアミドリ・5・(5・トリアルオワノテル・ L 3・・サアリアブール・2・イル) テオノテル・ - 5・セフエム・4・カルボン数(レン具性体) である特計第次の機関を52項影響の化合物かよ びその機関。

(55) 7 - (2 - メトキレイミノ - 2 - (5 - ア ミノ - 1.2.4 - サアゼアソール - 5 - イル) アセ トアミドリー5 - (5 - メテルアミノ - 1.3.4 -ナアゼアソール - 2 - イル) テオメテル - 5 - セ

フェム・4・カルボン酸(シン属性体)である特許前次の範囲第52項記載の化合物かよびその観報。

(94) アー(2-メトキレイミノ-2-(5-ア ミノ・1,24-サアジアソール・5-イル)アセ トアミドコ-5-(8-/アルー、2,24-アジ アゾール・5-イル)テオノテル・5-セアニ 4-ラルボン教(レン共性化)である特許前次 の場所83-3県記録の化を他と広げその様用。

(55) 7 - (2 - 1 + 4 + 1 + 2 - 2 - (5 - 7 \$! - 124 - 77077 - - 5 - 4 + 17 = 124 - 7 + 75 | 5 - (5 - 79 + 3 + 124 - 7 7077 - 4 - 5 - 4 + 1 + 2 + 4 + 5 - 5 - 5

謝水の範囲が3 2 寝記載の化合物かよびその塩料。 (86) (ア・ C 2 ・ バトサレイミン・2 ・ (\*5 ドア ミノ・ L 2.4 ・ チアジアゾール・ 5 ・ イル)アセ トアミドコ・5 ・ (\*5 - カルボヤシ・ L 2.4 ・ チ

エム・4・ガルボン酸(シン具物体)である特許

アジアソール・5・イル)チオメチル・5・セナ - エム・4 - カルボン酸(ビン具性体)である特許 勝求の範囲第52項配数の化合物シよびその収集。 (57) フーに2-メトキシイミノ・2-(5-ア

ミノ・ 1.2.4 - サアジアソール - 5 - イル ) アセ トアミド ) - 5 - ( 5 - ノトヤレカルボニル・ 1.2.4 - ナアジアソール - 5 - イル) テオノテル - 5 - セフエム - イ・カルポン酸 (シン具性体) である特許様本の暗露ある 2 項記載の化合物かよ

(58) x<sup>1</sup> がアミノ、x<sup>4</sup> がテアソリニルテオメ チルでもる特許前求の範囲第29項記載の化合物 かよびその実施。

びその事業。

(59) フ・Cユーメトホシイミノ・ス・(5 - ウ ミノ・ にえ・・ナアジアゾール・5 - イル) アセ トアミド) ・5 - (2 - ナアジリル・2 - イル) ナオノナル・5 - セフエム・4 - カルポン酸 (b レス性体) である仲計論なの機関第58 異紀娘の

化合物がよびその框架。 (60) R<sup>1</sup>、がアミノ又は低級アルカノイルアミノ、 R<sup>1</sup> が1個の低級アルキル、低級アルケエル、ヒ

ドロキン(任歌)アルキル、アミノ(任歌)アル

出る器プトキショルポニルフをソメナルエテル。

フセトフミドプロビル、1・フセトフミドメナル エチル、メトモレプロビル、メナルナホメナル、

スルホメナル、ジメナルアミノエナル、ジメナル アミノブロビル、カルボキシメナルもしく仕カル

ポキシニテルで個換されたテトラブリルテオメテ

特期 昭55-- 1 1 6 0 0 **(8**) ルである特許様式の範囲係 6 D 運動機の化会験を よびその塩素。 (62) 7 - [2 - / F + v 4 3 / - 2 - ( 8 - 7 ミノ・リスリーチアジアゾール・8・イル)アセ LT 8 E ) - E - / 1 - 4 + 4 - 1 E - + L + V ール・5・イル)テオノテル・5・セフエム・4 - カルボン袋(シン具体体)である純糸株式の筋 闘格も1項記載の化合物かよびその拡展。 (63) 7 - [ 2 - x + + v 4 2 / - 2 - ( 5 - 7 ミノ・1,2.4・チアジアゾール・8・イル)アセ トアミドン・モー(1・メチル・1日・チトラゾ ール・5 - イル)テオメテル・5 - セフエム・4 - カルボン酸(シン具性体)である妙許値求の低 悪節も1項記載の化合物かよびその拡削。 (64) 7 - [ 2 - 4 y Z o d + v 4 1 / - 2 -( 8 - アミノ・ 624 - チアジアゾール・ 8 - 4 ルンアセトアミドン・5・(リーメテル・1 #・ ナトラソール・5・イル)ナオメナル・8・セフ スム・.4 - カルボン酸(シン異性体)である特許

線水の範囲影61項記載の化合物かよびその框架。

(65) 7 - [ 2 - / hevis/ - 2 - ( 8 - 7 ミノ・ 124 - ナアジアゾール・ 3 - イル)アセ トアミドン・8 - (1・プロピル・1日・テトラ Y-w-8-4-14-4-8-47-4-4 - カルボン酸(シン異性体)である特許請求の 依頼係も1項記載の化み物かよびその集解。 (66) 7 - [2-11ev111-2-[8-7 1/- 124-+TVTY-N-5-4N)T# トアミドン・8・(1・イソプロピル・18・テ トラゾール・5 - イル ) テオノテル・3 - セフエ ム・4・カルボン酸(レン異性体)である特許値 求の範囲節61項記載の化合物⇒よびその塩製。 (67) 7 - [ 2 - / bev 4 2 / - 2 - ( 5 - 7 ミノ・ 1.2.4 - テアジアゾール・ 3 - イル) アセ トアミドコー8-(1-アリル・18-テトラゾ -w-5-4w)+#4+w-5-4724-4 - カルボン酸(シン異性体)である特許額求の能 開節61項記載の化合動かよびその監察。 (68) 7 - [2 - エトキシイミノー2 - (8-7 ミノ・ 1.2.4・サアジアゾール・3・イル)アセ

トアミドン・8・(1・アリル・18・テトラゾ ール・5 - イル)ナオメナル・5 - セフエム・4 - カルボン酸(シン具性体)である特許蓄水の塩 器幣61項記載の化合物かよびその拡展。 (49) フ・[2-イソプロポキレイミノ・2-( 3 - アミノ・リス4 - ナアジアソール・3 - イ ル)アセトアミド) - 8 - (1 - アリル・18 -テトラゾール・5 - イル)テオメテル・5 - モフ エム・4・カルポン酸(レン異性体)である特許 請求の戦闘的61項記載の化合物かよびその拡展。 (70) 7 - [2 - x + + + + 1 2 - 2 - (5 - 7 ミノー 1.2.4・テアジアゾール・5・イルリアセ トアミドリ・3 -[1 - (2 - ヒドロキシエテル) - 18-テトラゾール・5・イルコテオメテル・ 3・セフエム・4・カルボン酸(シン異性体)で ある特許能求の施務体61度記載の化合物をよび その単層。 (71) 7 - [2-= b+b/4 2/-2- (5-7

45 MI 8/255--- 1 1 6 0 0 00

- 1 E - テトラゾール・ B - イル ) テオノテル・
5 - セフエム - 4 - カルボン酸 (シン美性体) で
むる特許請求の処理官 6 1 項配収の化合他かよび
その数額。

(72) フ・(2・メトキレイミノ・2・(3・ア ミノ・1,24・チアジアゾール・5・イル) アセ トフミテ3・5・(1・(2・アミノギナル) -1日・チ・ラソール・5・イル) テオメテル・3 - マフエル・4・フルボン酸(ゲン酸を3)であ

- セフェム - 4 - カルボン級(レン具性体)である仲野勝次の範囲第61項記載の化合物およびその短期。

(75) 7-C2-1 トキレイミノ・2-(5-7 ミノ・5.24-サアウアソール・8-4ル)テ トプミア」-3-(1-(8-アミノブロゼル) -1日・テトフソール・3-4ル3テオノテル・ ゴ・セフエム・4-2ルポン酸(レン異性化)で ある特別最大の監督家・1 沢巨県の化る物かよび その監督。

(74) 7 - (2 - × b + v 4 2 / - 2 - (8 - 7 2 / - 124 - + T v T V - w - 8 - 4 w) T t トアミド) - 5 - (1 - (2 - アミノエテル) -1 E - テトタゾール - 5 - イル) サオメテル - 5 - セフェム - 4 - カルボン酸(レン異数水) である仲野協大の配数等61項配数の化合物かとびその数据。

(75) フー(2・エトヤレイミノ・2・(5・ア ミノ・124・アンリアソール・3・イルフで トアミジ・3・(1・(3・アミノブロビル)・ 1 ロ・チトラソール・5・イルファイナル・3・ セフェム・4・カルボン戦(レン異性体)でも る仲的最次の機関が・1 異配数の化を物をよびを

...

かよびその単類。

(76) フ・(2・インプロボキレイミノ・ミー (3・アミノ・1.24・サアジアゾール・S・イル)ア・ヒアミドフ・S・C1・(2・アミノ・ ナル)・1日・テトラブール・S・イル)アギノ テル・S・セフエム・4・タルボン酸(レンス酸 休)である特別様式の複雑形も1項形像の化合物

(77) 7 - C 2 - J 14 + 4 2 / - 2 - ( 5 - 7

...

トアミド) - 8 - C1 - (1 - アミノノテルエテル) - 1 日 - テトラゾール - 5 - イル) テオノテル - 5 - イル) テオノテル - 5 - ベルンス (セン民性体) である仲介語末の韓語が6 1 選記載の心会物シェびその意味。

ミノ・124・ナアジアソール・3・イル)アセ

(78) 7 - C 2 - J トキレイミノ - 2 - ( 6 - ア ミノ - 1,24 - チアレアソール - 3 - 4 ル) アセ トアミド) - 3 - C 1 - ( 8 - J トキレプロビル)

- 1日 - テトラゾール - 5 - イルコテオノテル -5 - セフエム - 4 - カルボン酸(レン異性体)で もる仲野原文の程度形 6 1 項記載の化合物かよび その振興。

その意味。
(79) フ・ビネーメトホレイミン・2 - (8 - ア
ミン・5.24 - サアジアゾール・5 - 4 ハ) アセ
トアミドラ・3 - (1 - メナルナオノナル・1 8
・テトラゾール・5 - 4 ル) テオメナル・5 - セ
フエム・4 - カルボン酸(レン再位件)である特別表の問題等61項記載の化合物かよびその製 類。 (82) フ・C 2・エトキレイミノ・2・(8・ア ミノ・3 2.4・サアワアゾール・8・イル) アセ トアミドン・8・C 1・(2・C 円 R・P J チル アミノ) エテル)・1 8・テトラゾール・8・イ ル) テオノテル・8・マフエム・4・カルボン数 (レン 異ない) である特別最大の地質等61 項記 歌の也の他かよびその意味。

特問 昭55-- 11600 80

(85) 7・C 2・ノトキレイミノ・2・(5・ア ミノ・1,24・テアピアゾール・5・イル アセ トアミテ) - 5・C (1・(3・C (大田・レノナル アミノ) アロビル・1 8・デトクゾール・5・ イル フォオノテル・5・セフエム・4・カルボン 際 (レン 異性外) である特を選求の範囲を41 項 記載のむを始めよびその意識。

(94) 7 - [2 - ノトキレイミノ・2 - [8 - ア ミノ・5.24 - ウアウアブール・8 - イル) アセ トアミドコ・6 - カルボキシノナル・1 エ - ナトラゾール・5 - イル) サボノナル・3 - エ アエハ・4 - カルボン酸 ( レン典技体 ) である仲 野樹木の処理等 6 - 現紀夜の化や倫かよびその版

(88) 7 - (2 - メトキレイミノ - 2 - (5 - ア ミノ - 1.2 4 - チアジアソール・8 - イル) アセ トアミドリ・5 - (1 - (2 ・カルボキシエテル) - 1 E - テトラソール・6 - イル) テオノチル・ 5 - セフエム・4 - カルボン酸 (レン異性体) で むも仲香物を心臓器が 1 単記版の配合物かよび (66) 7 - (2 - 4 ソアロボキレイミノ - 2 - ( (5 - アミノ - (2 4 - ナアピアソル・5 - 4 ル) アセトアミド) - 3 - (1 - カルボキレノチル・1 日 - テトラソール・5 - 4 ル) ナポノテル - 5 - 4 アエム - 4 - カルボン酸(レン長性体) びその回転。

\*\*\*

(87) al がアミノでa<sup>2</sup> が:他の低級アルカル 低級アルケニルもしく対策駅アルコネレ(低級) アルヤーで要換されたトリアンリルチボメチルで ある特別数なの機関第29項配載の化合物シェび その機能。

(88) 22 がノナルで、2<sup>4</sup> が1個のノナル、ア ロビル、アリルもしくはノトキシブロビルで収扱 されたトリアブリルテオノテルである特許額次の 電器第87項形象の化合物かよびその転収。

(89) フ・C マーメトキレイミノ・マ・(5 - ブ ミノ・5.2.4 - テアジアゾール・3 - イル) アセ トアミドン・5 - (4 - メテル・4 E - 5.2.4 -

トリアゾール・5・イル)テオノテル・5・セフ エヘ・4・タルボン酸(レン具性体)である特許 研究の観路か68 元配金の化合物を上げその観視。 (マロ) フ・6 2・ノトキレイミノ・2・(5・アー1ノ・5・イル) アセ トアミドリ・3・(4・アロデン・ル・5・イル) アセ トフ・メール・5・イル) テオノテル・5・セ フエム・4・タルボン酸(レン具性体)である特 形態式の機能を6 実形板の化合物をよびその展 版。

別の:
(91) アービューノトキレイモノ・コー(3-ア
ミンニ 5.2 4 - デブジアゾール・コーイル) アセ
トアミドリー5 - (4-アリル・ルコー 5.2 4)
トリアブール・3 - 4ル) テオノテル・3 - セフ
ホル・4 - カルン数 (レン員を作) である時か 原来の地類質 8 男配数のもの由上びその協議。
(92) ア・ビュニノ・キャレイミノ・コ・(6-ア
ミンニ 1.2 4 ・テアジアゾール・3 - 4ル) アセ
トアミリン・5 - ビス「(5-ア)・キャンデョルル
トアミリン・5 - ビス「(5-ア)・キャンデョル
イエ 1.2 4 - トリアブール・3 - 4ル) テャ テル・3・セフエム・4・ガルボン歌(シン美性 休)である特許請求の範囲形 8.8 項配載の化合物 かよびその複模。

(98) R<sup>1</sup> がアミノ、R<sup>4</sup> がピッジニルテホメナ ルでもる特許療法の処理落立。9 項記載の化合物か よび七の集構。

「(94) フ・じま・メトキャイミン・2・(5・ア ミノ・しま4・アプリアゾール・3・4ル) アセ ドアミアン・5・セラジニルテオノテル・5・セ アボル "4" コルボン取(シン異性体) である特 糸葉次の観音が975 項記載の化合物とびその数 (10)

(98) x<sup>1</sup> かアミノ、x<sup>4</sup> がテトラブロビリアリ エルテオメテルでもる特別要求の範囲第29 項記 他の化合物かとびその集構。

(96) R<sup>2</sup> ガンテル、エテル又はイソプロビルで ある特許書求の範囲形 9 5 項記載の化合物シよび その意味。

(97) 7 - (2 - 1 + 4 + 4 2 1 - 2 - (8 - 7 21 - 124 - + 7 + 7 + 7 - 8 - 4 + ) 7 + トアミドリーコ・(テトラブロじ 1.5 - トンビリ ガジン・4・イル)テオノテル・5 - セアエム・イカルン 乗(ルン 美性体) である特許者での 吸閉電りの別位戦かる ガレモン・2 - (5 - アェノ・1.24 - テアジアゾール・5 - イル)アセトアミドリーニ・(アンフィー・ストラブロじ 1.5 - トンビリアシン・6 - イル)テオノテル・5 - マアエム・コのベンショ(レン 54 特別ない 1.5 - セアエム・コのベンショ(レン 54 特別なの

ドジン・6・4 ル)テオメテル・5 - ヤフエム・4 - カルボン酸(レン角性状)である特別求の 昭開官りも現記他の化合物かよびその意味。
(99) フ・(2・インブロボやレイミノ・2・(3・フェノ・12・4・ナアロブソール・5・パル)フェトアミドリ・8 - (テトラブロ・(1.3

- b ] ビリダジン - 6 - イル)テオメテル・5 -セフェム - 6 - カルボン酸(シン異性体)である 特許額式の範囲等?6 項記載の化合物かよびその

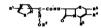
(100) R がアミノで、R がオキソ及びカルボ キレ(私表)アルキルで製扱されたジヒドロトリ アソロジョダリニルやオメチルである始新継承の ・ 製品的 2 り 製配的 2 ぴその 裏架。 (101) 吹き がノナルで、14 がオキソ及びカルボ キレノナルで置続されたシヒドット3 アプロビリ ゲレニルナオノナルである特別様の電影館 100 現記載の化を始か上びその業績。

(102) ア・( 2・ / トキレイミノ・2・ ( 5 ・ ア ミノ・ 1,2 4 ・チアウアゾール・5・ イル ) アセ トアミド J・5・ ( 2 ・カルボキレノテル・5・ オキソ・2,3 ・ジェドロ・ 1,2 4 ・トリアソロ ( 4,5 ・ b) ジェダジン・6・ イル ) テオノテル ・5・セフェム・4・カルボン酸(レン美姓作) である柳が離水の間間着10 1 形形をの化を含む である柳が離水の間間着10 1 形形をの化を含む

(103) k<sup>1</sup> がアミノ、k<sup>2</sup> が低級アルヤル、k<sup>4</sup> が水深、k<sup>2</sup> がカルボヤレである特許額求の掲載 第 2 項記載の化合物かよびその框架。

(104) 1 - [ 2 - メトキレイミノ・2 - ( 5 - ア ミノ - しユ4 - サアジアゾール・3 - イル) アセ トアミド) - 2 - メテル・5 - セフエム・4 - カ

1,0 5 項記載の化会物をよびその複類。



(文中 1 社アミノ又は保護されたアミノ、12 社会観アルテル、2 社本県又は信観アルテル、2 は本県又は信観アルテル、アレルテオ(伝統)アルテル、アレルテオ(伝統)アルテル、2 はされたいてもよい観楽機・マ は アルテル 2 はカルボルレスとは発達されたカルボャレをそれでお求ける)

で示されるセフエ▲化合物又はその框架を展示す る代謝し、一般式 55 (2007)



(式中 R <sup>B</sup> 、 R <sup>A</sup> 及び R <sup>B</sup> は失々的と同じ意味) で示される化合物<del>英語で</del>のアミノ基における反応 性簡単体又はせれらの複類に、一般式

(式中は、及び ロー 比欠・前と同じ意味)
(200)
で示される化の機器が そのタルボイン最にかける
反応性調学体文はそれらの温順を作用させること
を検索とするセフエム化の物気はその延順の影響

(106) 一蒙式

(式中型 はアミノ叉は保服されたアミノ、デ は低級アルテル、2 は水道叉は低級アルテル。 が、 は水流、アレルオキレ(低級)アルキル、ア レルナホ(低級)アルキル又は適当な関係基で数 鉄されていてもよい複素網チオ(低級)アルキル セモれぞれ意味する)

で示される化合物又はその塩類を複造するに際し、 一般式

(式中本<sup>1</sup>、末<sup>2</sup>、元<sup>3</sup>及びま<sup>4</sup> 校先々前と同じ 意味、末<sup>50</sup> 校保養されたカルボキシを意味する) で示される化合物又はその意質を、カルボキシ 能画の設施区がに付けてとを特徴とするモフェム 化合物又はその意質の製造力後。 (107) 一般文 (107) 一般文 特階 昭55-11600 (10)

(式中 R <sup>1</sup> はアミノ天は保護されたアミノ、 R <sup>2</sup> は近義アルサル、 R <sup>2</sup> は北瀬沢北信駅アルサル、 R <sup>2</sup> は北瀬沢北信駅下ルサル R <sup>2 b</sup> はアレルスは東西北海路高で撤済されていて よい南海浦式基、 R <sup>2</sup> はカルボヤレスは保護さ れたクルギヤレ、A 比信級アルヤレンをそれぞれ 煮味する)

で示される化合物又はその拡展を製造するだ際し、 一数式

(式中 x<sup>3</sup> 、 x<sup>2</sup> 、 x<sup>3</sup> 、 x<sup>5</sup> 及び A は失々数と 同じ意味、 x<sup>4</sup> \* は x<sup>4</sup>b - s - ( x<sup>4</sup>b は上記と同じ 意味)で示される基で整備され得る基を意味する)

で示される化合物叉はその観察に、一般式

(文中 x th 社前と同じ意味)
で示される化合物又はそのノルカブト基化かける
反応性病毒体を作用させることを特徴とするセフェム化合物又はその星葉の異意方法。

(式中末<sup>1</sup> はアミノ又は被職されたアミノ、末<sup>2</sup> は低級アルヤル、末<sup>3</sup> は水果又は低級アルヤル、 末<sup>4</sup> はエミノ(電級)アルヤルもしくはアミノで 屋換された複雑像サホ(低級)アルヤル、末<sup>5</sup> は カルボヤレ又は保護されたカルボヤレをそれぞれ 意味する) で示される化会地又はその業績を展表するに際し、 -- #b st

(式中 x 1 x 2 x 15 及び x 2 は欠々倒と同じ 意味、 x 2 は保護されたアミノ(低級)アルキル もしくは保護されたアミノで理論された医療器チャー (延載)アルキルを意味する) で示される化合物及はその重要を、アミノ保護器 の取除反応化サアととを特徴とするセフエム化合 物又はその重要の販売方依。

(式中 R<sup>1</sup> はアミノ又は保護されたアミノ、 R<sup>2</sup> は低級アルテルをそれぞれ意味する) で示される化合物及びカルポキレ基化かける反応 佐飾等体及びその拡展。

17

耐水の物面幣109項配載の化合物のシン具性体。 (111) R<sup>1</sup> がアミノである特許額水の報酬第110 項記載の化合物。 (112) 一般式

( 吹中 R だは扱アルキルを意味する) で示される化合物又はその複類を製造するに楽し、 一般式

(式中 8<sup>2</sup> 社前と同じ意味、 2<sup>18</sup> 社保装されたア

(式中 R<sup>2</sup> は上配と同じ意味) で示される化合物又はその塩類を作用させること を特徴とする約配化合物又はその塩類の製造方法。 (114)一般式

(式中 s\*\* はフミノ又は保護されたアミノ、 s\*\* は低機アルキル、 s\*\* は水塊支は低級アルキル、 s\*\* は水塊、アレルオキレ(低級)アルキル、ア レルサオ(低級)アルキル、大は無当を増換率で 味られたいてもよい裏楽顔サネ(低級)アルキル s\*\* はカルボキレ又は最麗サネ(低級)アルドヤレモ れぞれ遺址する) で示されるマフェル化ら物又はその展開を主収分 セナも毎回線を担予的・の無明を ミノを意味する) で示される化合物文はその塩質を、アミノ保護器 の脂酸反応に付けてとを特殊とする前配化合物文 はその塩原の製造力体。 (115) 一般式

ķ—<u>√</u> °-c∞

(式中車<sup>1</sup> はアミノ又は保護されたア<sup>1</sup>ノ、 <sup>2</sup> は低級アルキルをそれぞれ意味する) で示される化合物又はその延載を製造するに際し、 一般な

(式中車<sup>18</sup> は保護されたアミノ、車<sup>7</sup> は仮数アル ャルをそれぞれ意味する) で示される化合物を加水分解し、次いで得られた 化合物にな

発明の影響を設明
 この発明は、依備性物質として有用な一般式

もしくはそのアミノ義 にかける反応性酵母体 又はそれら希護療

又はその概算

# 方法 4

CA60KK#NT, 21 , 22 , 25 , びa5 は大々的と同じ意味でもり、a6m は保護さ れたカルボキレ、1<sup>40</sup> は高 1 <sup>40</sup> -8- ( 文中 2 <sup>40</sup> はアシル叉は通当な関接基で最後されていてもよ 。それらない。 、またいまで、 い後素素式基)で収換され得る基、Aは低級アル キレン、B<sup>48</sup>は上記を同じ意味、B<sup>40</sup>は保護され たアミノ(仮収)アルキルもしくは保養されたア

# 特問 昭55--11600 (12)

# 方鉄る

# ミノで収拾された複素素テオ(伝統)アルケル、 a<sup>46</sup>はアミノ(仏教)アルテルもしくはアミノで 要換された複素機チオ(低級)アルキルを失々意

この無明の出発物質のうち、化合物側は新規で もり、下記方法によって製造される。

Cれらの犬にかいて R<sup>2</sup> は上記と同じ意味、 R<sup>4</sup> はカルボキン基の保護器、 B はアルカリ金属、 R<sup>18</sup> は保護されたアミノ、 R<sup>2</sup> は任歌アルキルを失々

目的物質(I)及び出発物質関化かいて、下記式で 示される部分構造は

できる。 「点<sup>\*</sup>」 「成 (女中来<sup>\*</sup> はイミノ又は保証

されたイミノ)の式で扱わすこともできる。即ち、 上記の基別及び頃は下記平衡式で示される夏安具 作の状態で存在し得るものである。

(式中車<sup>1</sup> 及び車<sup>1</sup> は大ヶ前と同じ意味) この明報書(仲計解末の範囲及び宍路網を合む) にかいては、上記の基を有する目的物質及び出発 物質は、仮宜上それらのうち一方即ち式

で示される基化よって代表的に表現することとす A.

自的物質(1)の複根としては常用の塩類が挙げら

特別 昭55--- 1 7 6 8 (13) 下記式で示される最何異性体の何方を含むものと して理解されるべきである。

展されたアミノ)で示される基が、目的物質及び 出発物質にかいて式: g1 (式中間

は前と同じ意味)で示される基でもる場合は、式 また。 で示される基はその互変異性体

れ、無機欲し例えばアルカリ金属塩し何えばナト リクム塩、カリクム塩菓ン、アルカリ土製金属塩 (何えばカルシウム塩、マグネシタム塩等)等の 金属製、アンモニタム塩等);有機塩に何えば有 後アミン塩(何えばトリメテルアミン塩、トリエ チルアミン童、ビリジン童、プロカイン盤、ピコ リン塩、ジンクロヘキシルアミン量。 3.パージベ .ンジルエチレン - ジアミン塩、ガーメテルグルカ ミン塩、ジェタノールアミン塩、トリエタノール アミン盤、トリス(ヒドロキシ/テルアミノ)/ タン塩、フエコルエチルペンジルアミン塩、ジベ ンジルエテレンジアミン生物)等:有機カルボン **歳又はスルホン散塩 [ 例えば酢酸塩、マレイン酸** 塩、増石酸塩、メタンスルホン酸塩、ペンゼンス ルホン表生、トルエンスルホン酸塩等31無機酸 **湖 [ 供 : 过发音法。是化水谱音集、延散器、排除** 数学〕(編集住成は原住アミノ歌との数〔何えば ナルギニン塩、アスパラギン酸塩、ダルタミン酸 型、サジン置等)等が何分される。

この明細帯にかける最々の例示並びに各種定義

韓間 昭55─ 1160 0(ta)

の説明等化ついて、本ி明の技術的概器化包含されるもの世界雑化法べると下配の如くである。

「住職」なる用語は、別後の定めがないかぎり 1~6個の炭素原子を有する基を意味する。

根数をれたアミノの呼渡例としては、アレルア ミノがあり、その他では、アレル面以外の内用段 歳高荷えばアリール(仮装)アルキル(男えばペ ンタル、トリナル等)、アリール(仮装)アルマ サアン(例えばペンジリデン等)、仮数アルコキ レカルボエル者しくはジ(仮数)アルキルフミノ で置換された低数アルキリデン(例えば1・エト ルレカルボエル・2・プロビリデン、ジノテルア ミノバタレン等)、ホスノ等の基で置換された エミノが身位をされる。

保装されたイミノの好産例としては、アレルイ ミノがあり、その他には、アレル高以外の爪形依 装る例えば前紀アミール(住政)アルテル等で置 接る例えば前紀アミール(住政)アルテル等で置 接されたイミノが包含される。

アレル及びアレルアミノ、アレルイミノ、アレ ルオキシ(仮表)アルキル及びアシルチオ(低級)

アルキルにおけるアレル部分としては、カルパモ イル、動助能アレル基、及び労吞職費しくは復業 乗り会りアシャ基が包含される。 そして前記アシ ルの終遺例としては、低級アルカノイル(例えば ホルミル、アセテル、プロビオエル、アテリル、 イソプチリル、ハレリル、イソハジリル、オキナ ちゃ、ナタシニル、ピパワイル等で、好ましくは 炎泉歌1~4個、変に好せしくは炭素歌1~2個 のもの):炭素数2~7個の低量アルコキシオル ポニル(何えばメトキシカルポニル、エトキシカ ルポニル、プロポキシカルポニル、1 - シクワブ ロビルエトキシカルボニル、イソプロボ キシカル ポニル、プトキシカルポニル、低る数プトキシカ ルポエル、ペンテルオキシカルポエル、佐ろ根ベ >+++++VD+#E#, ~+V##+VD## ニル等で、好ましく社类素数5~6個のもの); 在最アルカンスルホエル(何えばメシル、エタン スルホニル、プロバンスルホニル、イソプロパン スルホエル、ブタンスルホニル等);アレーンス ルホニル(何えばペンゼンスルホニル、トシル等)(

アロイル (例えばペンジイル、トルオイル、テア トイル、アドロイル、インデンカルボニル等): アリール (仮説) アカドノイル (例えばアエニル アセテル、アエルンプロビオニル等): アリール (伝統) アルコキレカルボニル (例えばペンジル オキシカルボニル、アエネテルオキシカルボニル 等) 等が開発される。

ノチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソプテル、第5級プテル、ペンテル、第2級プテル、ペンテル、第5級ペンテル、ヘヤレル等があり、より好ましいの
は炭素数1~5種のものである。

保護されたカルボテンとはエステル化されたカ ルボキンを含むものであり、故エステルとしては 例えば低級アルテルエステル(例えばメテルエス テル、エチルエステル、プロビルエステル、イソ プロビルエステル、ブチルユステル、イソプチル エステル、第5数ブナルエステル、ペンテルエス テル、筋5酸ペンテルエステル、ヘキシルエステ ル、1・シクロプロビルエテルエステル等であり、 放低級アルキル基は炭素数1~4個のものが好せ しい)(佐根アルケニルエステル(何えはピニル エステル、アリルエステル等)(低級アルキニル エステル( 何え位 エチェルエステル、プロピニル エステル等)~モノ(又はジ又はトリ)へロ(佐 数アルキルエステル(何えば2・ヨードエテルエ ステル、222・トリクロロエテルエステル等);

新典アルカノイルナルシ(新典)アルカルエステ ル(何えばアモトキシメテルユステル。プロビオ ニルオキレノテルエステル、プチリルオキレノチ ルエステル、パレリルオキレメテルエステル、ビ 1010444VITHERFN. ~\*\*\*\* キレメナルエステル、2・アセトキシエテルエス ナル、2・プロビオニルオキシエテルエステル等)」 任数アルカンスルホニル(任額)アルキルエステ ル(何まピメシルメテルエステル、2・メシルエ ナルエステル等)(アリール(任義)アルテルエ ステル、何えばフエニル(佐根 ) アルキルエステル で、これは1岁けぞれ以上の豊後本でされていて もよい(個えばペンジルエステル、4・メトキシ ベンジルエステル、4 - ニトロベンジルエステル、 フェネナルエステル、トリナルエステル、ジフェ ニルメナルエステル、ピス(メトキシフェニル)

メチルエステル、 3.4 - ジェトキレベンジルエス テル、4 - ヒドロギン・3.5 - ジ第5級プテルベ

ンジルエステル等)11又はそれ以上の最終高を

ぎしていてもよいアミールスステル (何まげフェ

特期 昭55-- 11600(15) エルエステル、トリルエステル、第5級プテルフ ユニルエステル、キシリルエステル、メレテルエ エテル、ナメニル エステル等 ) 等が例示される。 品乗されたカルボテシの好すしい何としては、 SBT 43 4 2 4 4 4 5 4 ( 何まけ / トキシカル ポニル、エトキシカルポニル、プロポキシカルボ エル、プトウンカルボニル、 気を数プトウンカル #=# #58424######## A. \*\* シルオキシカルポニル等の如く炎症数2~7番の もので、行せしく比炎者数2~5億のもの)やフ エニル(仏教)アルコキシカルポニル(エトワで 2\$ 世後されていてもよい、何えば4・エトロペンジ ルオキシカルボニル、ペンジルオキシカルボニル. 4 ・ニトロフエネチルオキシタルポニル等)等が 都示される。

板瀬田式高及び駅前報子さ(板根)アルキルと いり用語化かける板頂報係分とは、少なくとも1 つの収集第十 (何大収象、現余、配乗等)をも があわざしくは不由和、単数がしくは手配の収集 数式高を示す。そして中化的としい板頂板式高と

しては、何えば意楽!~4 個を有する5~8 長不 毎和崔潔康式基「何えばピロサル、ピロリエル、 イミダブリル、ピラブリル、ピリジル、そのH‐ #444 F. E920W. E90=W. E980 エル、トリアゾリル(例えば4日 - 1.2.4 - トリ T/9 m, 1E - 1.25 - 1 5 T / 9 m, 2 H -1.2.8 - トリアソリル等 )、テトラゾリル(何え ば1日・テトラブサル、2日・テトラゾサル毎) 等3、管案1~4個を含する5~8乗機和協会部 式苗(何えはピロラジェル、イミダブリジニル、 ビベリジノ、ビベラジュル等)(窒素1~5個を 有する不無和船会被需要式器(例えばインドリル イソインドリル、インドリジエル、ペンズイミダ プリル、キノリル、オンギノリル、インダブリル、 ペンプトリアブリル、テトラブロピリジル、テト SYOCEFULA, DEFELETYOUSE ジェル等)(最素1~2個及び窒素1~5個を含 むる~8長不備和複素環式基に例えばオキナソリ ル、イソキサブタル、オキサジアブリル(何えば 124・オケナシアゾリル、しら4・オケナンア

プリル、し2.5・オキサジアプリル等)等:農業 1~2個及び窒素1~3個を含む5~8美能和複 素素式品(何えばモルホリエル等); 散業1~2 個及び音楽1~5個を有する不能和組合複型音式 盖(何えばベンズオキテザリル、ベンズオキテジ アプリル等) 1 現代1 ~ 2 側と宣宗1 ~ 5 倒を合 む5~8 異不無効複素療式基[ 個えばチアソリル、 チアグリニル、テアジアブリル(何えはし24・ ナアジアソリル、 しる4 - ナアジアソリル、 1,25 ・ナアジアプリル等)等)に延食して2個及び世 第1~8個を含む5~8美雄和複素環式器(例え パテアゾリジュル等):蘇美 1個を合むる~8長 不備和被索索式盖(例えばテエニル等) | 蔵黄1 ~ 2 個及び間増1 ~ 5 個を合む不無和総会提業機 成長(何えばペンソチアグリル、ペンソチアプロ ル等)等が挙げられ、上記の複葉最式基は1~2 傷の遺当を開始基を有していてもよく、数量機能 としては、低級アルキル(例えばノナル、エチル プロピル、イソプロピル、アテル、イソプテル、 ペンテル、ヘキシル等で、終まじくは炭素数1~

Christis . Burna han charren ケニル(例だはビニル、フリル、プテエル等でお ましくは音楽歌2~5個のもの):長田アルケル ルテオ(何えばビニルテオ、アリルチオ、ブタテ ニルテオ等で、好ましくは表示数2~3個のもの)。 アリール(何えばアエニル、トリル等)(ハログ ン(何えば崔忠、美忠、妖衆又は弗君)(アミノ) ジ(佐根)アルキルアミノ(佐根)アルキル(何 \$H01++71/1++, 01++71/5+ A. DITATELTOCA, DETATELT ロビル、ジェナルフェノブナル等) ( カルボキレ (長根)アルキル(何えばカルボキシメテル、カ ルボキシニデル、カルボキシブロビル等、好きし / #### 1 ~ 4 # P 4 P 3 / 5 4 P 4 P 5 P 4 カルボキシ(仏装)アルキル(エステル化された カルボキン殊品は前紀情景のとかり。)(アミノ (佐根)アルテル(何えばアミノメテル、アミノ エチル、アミノブロどか、1-アミノメチルエテ ル、アミノブテル等で、好ましくは民衆教1~8

**韓間 駅55--- 1 1 6 0 0 (18)** 無のもの)に保護されたアミノ(状体)アルキル 「蘇集されかするノアび延用アルラル機器は如配 表示のとかりて、好ましくは低級アルコキシネル ボニルフミノ(長井)アルキル(噴えば!トキレ オルボニルアミノメナル、エトキシカルボエルフ 1ノメチル、吹る曲ブトキレカルポニルアミノノ ナル、ある世プトキシカルポニルアミノエナル、 # 5 # 7 10 v + 0 # 5 0 T 3 / 7 0 C 0. 1 -取るボブトキレカルポニルアミノメテルエテル等 ペアルカノスルアミノ(仮数)アルキル(何えば アセチルフミノリテル、フモテルアミノニテル、 アセテルフミノブロビル、1・アセテルアミノメ テルエテル等で、より好ましくは供来を20~5番 のもの)」」カルボキレし上記で何示されたエス ナル化されたカルボキレで、好ましくは低級アル コキシカルボニル、更に好せしくは炭素数を~5 個のもの(低級アルコキシ(低級)アルキル(何 えはょトキレミチル、ノトキレニチル、ノトキレ プロピル、エトチレメテル、エトキドニテル等で

好ましくは表謝数を~5個のもの)」と「ロヤビ (低級) アルテル (何えばヒ ドロテレイテル、ヒ FRAUETA, EFRAUTOEN, EFRA レプテル等で、好せしくは供収数 ( - 5 個のもの); 在表アルセルテオ(低級)アルセル(例えばメナ ~+#/+w. /+~+#=+#. /+~+#7 \*ビル、エテルテオノテル等で、好ましくは供業 歌でーを借のもの)(スルム(佐根)アルサル (MEHINASTA, ZNAZTA, ZNAT マピル、スルトアナルギで、好せしく社会会会も ・・ルスびを終了ルキル基は上記側示のとかりで、終 こっさしくは低級アルカンスルホニルル亜級リアルタ から何えはメンタイナル、インガニナル、干さと スルルスルメテル中)で、より捉ましくは炭素飲 2~8個のもの」(アンルアミノ(佐藤)アルキ ルしてレル及び低級アルキル民義は上記何示のと かりて、好せしく社会表アルカンスルホニルアミ ノ ( 佐根) アルモル ( 例えばノレルアミノノテル | VATE | = + W. | VATE | 7 = KA. =

#### |R性 8-できたも基で重接され得る基 とには、アジド、 |特託トロザン・アンルオキン ( けおには 16 項 |プルロ 11ルオキン ) 等が 登せられる。

低級アルルレンとしては民意教1 - 4 他の最終 収支は分数は1 他期間限度を求禁が基をも合う。同 えば、ノチレン、エテレン、ア・アルトラリン、ア ロビレン、1 ミエチレン、ア・アルトラリナレ デオエチレン、2 - アルトラリナレ デオエチレン、2 - アルトラリナレ デオエチレン、2 - アルトラリナレ デオレーのは実施数1 - 4 他、文化学エレー デオレーのは実施数1 - 2 他、文化学エレー は最重な1個である。

ま<sup>6</sup> 及びま<sup>14</sup>で示される複雑機チャ(根表)アルキル化かける保養されたフェノ(低表)アルキル、保護されたフェノ及びアミノ(低級)アルキルについては、大・上記で何宗されたものが序び 個打ちれる。

カルボキレの好意保養高としては、エステル化 されたカルボルトドかける前配例ボウロスステル表 高を再び続けることができる。カルボキレ保養系 の好適何を挙げると、上記の低数アルキルが示さ れる。

好達なアルカリ金属としては ナトリウム、カリクト及びミチウムが挙げられる。

目的物質(1)の好産例は下配の如くである。

ま<sup>1</sup> の好趣向は、ブミノ、アレルアミノ(より 好主しく比性級アルカノイルアミノ)、ダ (転載) アルキルブミノ(低級)アルキリデンアミノ又は ホスホノアミノであり! E<sup>2</sup> は低級アルキル! E<sup>3</sup> は水源又は低級アルキル! E<sup>3</sup> は水奈! アレルボ ホレ(低級)アルキル(より好ましいのは低級ア 特別 約55-- 11600.17

ルカノイルオキシ(新華)アルキルを仕立かべる イルオキシ(仏教)アルキルで、更に好せしいの は長級アルカノイルオキレノテル又はカルバモイ ルオキンノテルである)(アンルテオ(仮表)ア ルキル(1り行きしいの社任義アルカノイルテオ ( 仏蔵 ) アルキルで、更化好ましいのは低級アル カノイルナオノナルである)(仏装アルキル、仏 紙アルケニル、低級アルコキシ(低級)アルキル、 ##T##### (## ) T###. E FO## (低級)アルキル、アミノ(任根)アルキル、低 コアルコルシャルボニルアミノ ( 長妻 ) アルルル 低級アルカノイルアミノ(仮数)アルキル、ジ (低級)アルテルアミノ(低級)アルテル、スル \*(低級)アルキルもしくはカルポキシ(低級) アルキルで置換されたテトラブリルテオ(任根) アルカル (好ましくはテトラグリルナオノナル) ト 低級アルテル、低級アルコテン(低級)アルテル、 低級アルキルチオ(低級)アルキル、低級アルケ ニルチオ、カルボキシ、任義アルコキシカルボニ ル、ヒドロキン(仏教)アルキル、アミノ(仏教)

アルキル、低級アルコキシカルポニルアミノ(低 扱うアルキル、アミノ、仮数アルキルアミノ、ハ ロ(低級)アルテル、カルボキシ(低級)アルキ ルテオ、低級アルカンスルホニル(低級)アルル ル、公扱アルカンスルホエルアミノ(仏教)アル キャもしくはカルボキレ(仮数)アルキルチオで 産換されていてもよいテアジアゾリルチオ(低級) アルキル(より好せしくはチアジアゾミルチオメ チル):仮根アルキル、仮根アルケニルもしく比 アルコキレ低級アルキルで最後されたトリアプリ ルチオ(低級)アルキル(より好せしいのはトリ アゾリルテオノテル)(ピクジニルテオ(仮要) アルキル(より好ましいのはピラジニルチオメチ ル);テアンデルテオ(佐根)アルキル(より好 えしいのはチアソリニルチオメチル) 1 テトラゾ ロビリダジニルテオ(仮数)アルキル(より好せ しいのはテトラゾロビすダジニルテオメテル)( 又はオキソ及びカルボキン(低級)アルキルで置 挟されたジヒドロトサアプロピリグジェルテオ (長の) アルキル(より好ましいのはジヒドット

すアソロビリダジュルテオメテル)』 2<sup>5</sup> はカル ボヤレ又はエトロで最終されたフェニル(低級) アルロキレカルボニルである。

上記目的物質の製造機は以下部途する悪りである。 方数1

目的物質(以まだなその框架は、心を他向もしく はそのアミノ基にかける反応性物学形式はそれら の框架は、化合他向もしくはそのカルボキレ基に かける反応性物学形式はそれらの框架を作用させ あことによって寄られる。

心会も明のアミノ系にかける反応性関係なしては、アミドを反応にかける氏用の関係は、例え なたも期向とカルボニル化合物との反形だって 形成されるシファの裏面交互でも至実見性化係る エナミン間異性体:化合物のアシリル化合物、例 及ばされくトラリナルンフマドアミド、ト リゾナルレリルアマトアミド等を反応させて得ら ホカッサル勝等件:化合物のと3 単化的との反応 によって得られる簡単体学を挙げることができる

特期 昭55-11600 (18)

化合物側の好産な販販としては、限付加払、例 尤指職業は「何えば耐食味、マレインで乗、別 石酸塩、ペンギンスルホン酸塩、トルエンスルル 必数率り・申職機塩に何えば電産塩、資金塩、 経産塩、卵産塩等) | 金田塩(何えばナトリウム塩 等) | アンモニタム塩、オグネセタム塩 等) | アンモニタム塩、オグネセタム塩 等) | アンモニタム塩、オグネセタム塩 等) | アンモニタム塩(何えばト リエナルア ミン塩、ジレクリヘキシルアミン塩等) ※が何次される。

化合物間のロルボキン薬だかける反応性病學体 としては、数かライド、微様末物、筋性アミド、 低性エステル等が何示される。これらの好真何を がげると、数クロライド! 数アジド! 環境病酸 (何えはリアルギル病酸、フエニル病酸、ジフニ エル病酸、ロバンジル病酸、ハロゲン病療等)、 ジアルキル医病数、塩尿酸、マオ温酸、温素、ア ルギル皮酸、脂肪酸カルボン酸(何えばビバリン 根、百事数、4ツ哲事数、2・エチル脂酸、溶液、 トミテロロ酸酸等)の新との患の最高を出来物! 消費 (対象点形象) のおとの患の患を発生が実施 水柏(イミダゾール、ジノナルビラゾール、トリ アゾール収はテトラゾール等との話性アミドリ語 性エステル(何えばシアノメチルエステル、メト キレノナルエステル、ひノナルイミノノナル [(CH<sub>2</sub>), -H'=CH-) =xfn, E=n=x テル、プロハルギルエステル、ョ・ニトロフエニ、 \*\*\*\*\* 24 - Paterzansx\*\*. ・リクロロフエニルエステル、ペンタクロロフエ ルナゾフェニルエステル、フエニルテオエステル、 a - ニトロフエニルテオエステル、a・クレジル ナオニステル、カルボキシメテルテオニステル、 ピラニルエステル、ビリジルエステル、ピペリジ ルエステル、8・キノリルテオエステル、又は 男男 - ジメテルヒドロギシルアミン、1-ヒドロ 4 - 2 - ( 1 E)- E + F>, # - E FO4++ クシンイミド、ガーヒドロキシフタルイミド家は 1 - E FORD - 6 - 9 D D - 1 B - 42 9 + 9 ナゾールとのエステル等)を何示することができ る。これらの反応義を強は、化合動剤の業績化応

## じて油食表択すればよい。

化合物間の電報としては無機能高との低く何え ピアッカリ金属版(何えばナトリウム版、カリウ 本等)、アルカリニ酸金属(何えばカルリウム 版、マグネレウム版))| 可能能高(何えばトリ メテルフム版))| では他高(何えばトリ メテルコン、ドリエンの の版 1版(何えば世歌、美歌)との選挙が何景さ れる。

反応は、民用器集中で行立りのが一般的であり、 政器集としては末、アキン、リオキッン、アセ トニトリル、クロッキルム、塩化ノテレン、塩化 エテレン、アトフヒドロフラン、砂酸ステル、 R.ド・ピノテルホルムアミド、ビリジン、仮位こ の反応に感覚を全人主心もつ他の有効を置か何 示される。これらの路線のうち親水位路底は水と の馬の指揮をして使用するとともできる。

ヘキシル・ポー(4・ジェテルアミノシクロヘキ シル ) カルボダイミド | ガガ・ジェチルカルボジ イミド・ロボ・シイソプロビルカルボジイミド。 H-ニチル・H-(8-ジメナルアミノブロビル) カルボジイミディボガーカルボニルビス(2-5 チルイミダゾール) | ペンタメチレンケチン・N ・レクロヘキシルイミン | ジァユニルケチン - # ・シクロヘキシルイミン(エトキシアセテレン) ポリ情報エテルドポリ講像イソプロビルトロエチ ルホスホロクロリダイト | オキシ塩化的 | 3塩化 供 1-5 塩化餅 1 塩化テオニル 1 オキデリルクロラ 4 F1 F472204274218-244-7 ・ヒドロキシベンズイソキサゾミタムフルオロボ ーレート | 月・エチル・5・フェニルイソキサゾ 994-8-2044-111-(9-9000 ンゼンスルホニルオキシ) - 6 - 90 ロ・1 ※ -ペンゾトリア ゾール : 所聞ピルスマイヤー放業 (例えばひメナルホルムアミドと催化ナオニルヤ ホスゲンとの反応化よって得られる ( クロロメチ レン)ジメチルアンモニタムクロライド、夏仕ジ

特期 昭55--- 1 1 6 0 0 (19)

メナルホルムアミドとオキレ製化師との反応化よって得られる化合物等): 等の存在下化行なうのが好ましい。

反応は、又が根な高収が無機電高例えば以下例 示する様々本級化アルカリ金属、炭酸電解アルカ リ土根金属、炭酸アルカリ金属、ウ酸アルカリ金 属、トリ(低酸)アルキルアミン、ビリジン、は (低酸)アルキルモルモミン、メメージ(低酸)アル キルアニョン等の存在下に行きうこともできる。 最高又は輸金所が収録であるときば、蒸業を受力 で用いることもできる。反応値度は制度が立く、 減増性的所が収録であるときば、蒸業を受力 で用いることもできる。反応値度は制度が立く、 減増は内が呼びは高度に利度がある。

この反応においては化合物例に対して化合物例 のレン具性体を反応させることにより、目的物質 (I)のレン異性体を参享立く呼ることができる。

との反応にかいては、反応条件にようを合物的 中のま<sup>1</sup> で示されるアミノ高が、反応中に保護さ れたアミノに収換するとともあり、との様な場合 もとの方法の機関に含まれる。

が歌、音歌、プロピオン歌、トリアルオロ野歌等) 及び無暴歌(何えば塩歌、臭化水景歌、温歌等) が挙げられる。

灰店は一般によ、アルコール(棚をはメタノー ル、エタノール等)、それらの集合物、彼はとの 反応の流行に感影響を与えない他の密集の存在下 に行なわれる。 塩基及び酸が液体であるときは酸 紙として使用することもできる。反応温度は制限 的でなく、一般には冷却乃至加量下に行なわれる。 雅元は、保護基例えば4・エトロペンジル、2 - - - + F=++, 222 - + 1700 = +++ の配産の場合に採用される。配蔵反応に適用でき る道元反応としては、何えば金属(何えば豊倍、 亜鉛アマルガム等)収はクロム化合物の塩(何え は塩化クロム、酸酸クロム等)と有機或は無機酸 (何えば酢散、プロピオン酸、塩酸等)との概み **らわせて行なり方法;汎用の金額無能(例えばべ** ラジウムー供表 ) を用いて行たり一般的力能能量 元年が挙げられる。

## 方族 2

目的物質(Is) 欠はその複類は、化合物(Is) 又はその複類を、 ウルボキン保養基の酸類反応に 付すことによって得られる。

化合物(!a)の好道程としては、化合物間だか いて個示された酸分加度が再度挙げられる。

この反応は常歩例えば加水分解や選先等の方数 にかって支付される。

保護器がエステルである場合には、加水分類に よって協能される。加水分類は悪悪疾は駅の存在 下代行をわれる。野増也最悪としては、保候塩素 仮は有級塩塩、倒えばアルタリ金質(ナトリテル サカリウム等)、アルカリ土質金質(マグネシリ ルマカルシウム等)、それらの未銀化物、沢原味 メナルアミン、トリエテルアミン(何えばトリ メルアミン、トリエテルアミン等)、ピコリン、 13 - ジアザビンクロ(える13)メン・5 - エン、 14 - ジアザビンクロ(える23)オフクン、18 ・ジアザビンクロ(える03)アンデセン - 7等か がげられる。野増を設定としては、有器数(例えば

# 方换 5

目的物質(14) 又はその種類は、化合物(1c) 又はその複類に化合物的又はそのメルカプト基に かける反応性病準体を作用させることによって製 最もれる。

化合物(ie)の貯蔵板としては、化合物側に対 して何示されたものを再ねてきる。

化合物的のノルカプト選にかける反応性酵母体 としては、金銭製料及はアルカミ金銭製料(料及は ナトリウム塩、カリデム塩等)等が行うれる。 この反応は、温管、水、病物設実が、アセトン、 か、エリール、エリロペンペン、塩化メナレン、 塩化エナレン、ジメチルルルンミド、メタノール、エリノール、エリール、アリカルラでで、 サンチルルルルンド収はこの反応の運行に悪影響を学えない形成、特に好えしくは強い機能を対して のよの場合でで、これのような 最本性のものはよとの現合関係として利用することもである。反応比中性機能や単純に行なのの呼び ともである。反応比中性機能やで行なりのが呼ば いの。化合物(110)収はなる他的を連鎖の状態で

特期 昭55--11600 (20)

用いるときは、塩素(例えば水変化アルクリ金属) 灰板アルリタ金属、炭板水溶アルミリ金属の助き 最低温高度はトリアルキルアミンの助き有機服务 等)の存在下に行なりのが好えしい。反応温度は 制限されず、一般的に当属、加能乃差者干の加熱 下に行なわれる。 方族4

目的化合物()11) 又はその無限は、化合物()10) 又はその複類をアミノ保護器の脱離反応化付すこ とによって影響される。

化合物(1e) の貯産を築としては、前配の様な 金属塩、アンモニウム塩、有機アミン塩が含まれる。

との股限収的は、常供得人は加水分析: 意兄! 保護高がアレルである場合化化合物(!o)をイセ ノハログン化剤と反応し、次いでイミアニーテル 化削と反応し、必要であれば反応加水分解する力 使等化よって支行される。加水分解後は歳、福延 成化ドアリンン を用いる力を全合し、これらの力 依は、数据さるべき保護品の機能によって変質量 依は、数据さるべき保護品の機能によって変質量 Rens.

これらの方味のうち、歳を使う加水分解係は、 我最高が顕微さしくは赤理検ブルコキシカルボニ ルく何えば暫ち数ペンテルボキシカルボニル、 筋 ちまデトラセカルボニル等)、アルカノイル(例 えばホルさル等)、レクロアルコキシカルボニル(例 えばホルさル等)、レクロアルコキシカルボニル(例 えばペンジルボキンタルボニル 要換ペンジルボ サンカルボニル等)、環境アユニルテオ、理検ア テルキリデン、環境アルニリデン、環境レタロアルキリデン、環境アルモリデン、で ボール・フィー・マール・フィー・マール・フィー・マール・フィー・マール・マーのである場合にかいて氏 用きれ且つ迎ましい方体である。

好すしい世として比古典歌、出意からり、何 えばず歌、トリアルオロ前歌、ペンゼンスルムン 歌、トリトルエンスルムン歌、歌歌寺が挙げられ る水、「より好せしいのはず歌、トリアルオロ歌歌 歌歌寺である。反形に部合の良い様は、劉華さる べき代裏本の電報におじて満代される。歌歌氏店 を取り行さう場合には、編巻なおしくは無な

在下に行なわれる。厚ましい路線とは、汎用有機 溶線、本及びぞれらの機合物を含む。 トリアルギ ロ密軟を用いるときは、アニソールの存在下に反 必を行なうのが好ましい。

ヒドラジンを用いる加水分解は、キクシェルヤ フォロイル等の保護基の設理反応として一致的で ある。

電車を用いる加水分解は、アセル系に何えだハ ロアルカノイル(利えばジウロのアセナル、トリ アルカロアルやリ)2の陰原反応に対点である。 好確な策をとしては、無機塩を(利えば水酸化ア ルカリ土間(列えば水酸化アトリウム、水酸化ル ロウム等)、水酸化アルカリに倒金属(例えば水 酸化マグネシワム、水酸化のルレタム等)、炭酸 アルカリ土質(例えば火酸ナドトリウム、炭酸カリ クム等)、炭酸アルカリ土質土原金属(例えば火酸中 グネシリケム、炭酸カルレタム等)、炭酸水原アル カリ金属(例えば炭酸水溶ケトリウム、炭酸水原 カリウム、炭酸カルレタム等)、炭酸水原アル カリカリス(例えば炭酸水溶ケトリウム、炭酸水原 カリウム・炭酸カルレタム等)、炭酸水原アル カリウム・炭酸カルレタム等。 全質(現代開発マグネレタム、開発カルレタム 等)、特殊水果アルタリを選(例えば何数水用 2 ナトリアル、何数水用 2 カリアルマリ 9 つ、7 研 裏温に何えばトリアルやルア 2 シ、ピコリン、コー ノテルでもフシ、スーノテルをからし、15 ・ジアデビンクロ(5.0) / シー 5 ・エン、 14 ・ジアデビンクロ(5.0) / シー 5 ・エン、 ・14 ・ジアデビンクロ(5.40) / シー 5 ・ラン ・ジアデビンクロ(5.40) / シー 5 ・ラン ・ジアデビンクロ(5.40) アンデセン - 6 等 J が含まれる。製温を用いる加水分解は、しばしば 水、質用用機能模型だせたらの最も他中で存立 りる。

保護者のうち、アレル者は一般化上記或はその 他共用加ま分別化よって段機される。アレル者が リニガン医機アルコモレカルボニル或は6・キノ リルエモレカルボニルであるときは、減金両利え 短期、服用等で発展することによって影像される。 減元的影似形形は、保護者が成の後をものであ さらも、即ち何えばハロアルンコモレルボニル・ (例えばトリテロコニトモレカルボニル・ 換着しくは非職機アフルコヤレ刃ルボニル(個人 はベンジルオキレヨルボニル、最換ペンジルギネ レカルボニル等)、2 - ビリジルメトキャリルボ ニル等の場合に一般的に適用される。 経えしい最 元反応とは、個人は水単化性カボアルコリ金属 (個人は水単化性カポトリウム等)等を用いる 方板を含むものである。

灰 店舗皮は制製的ではなく、アミノ保護品の指 駅、配用反応の程駅に応じて連収設定され、停ま しくは、緩和な条件、即ち、冷却下、定量下又は お干の加熱下に行なわれる。

この反応化は、R<sup>3</sup> で示される発表されたかル ボキンが反応の進行中又は彼易差中に遊儀のカル ボキンが反応の進行中又は彼易差中に遊儀のカル ボキンに更換される場合を含むものとする。 出発物質期の製造株を以下算過する。

## 製造供(1)

化合物側は化合物例叉はその複額化、ハロゲン 化剤及び化合物側を作用させることだよって製造 される。

この方法で用いられる好慮なヘロゲン化剤とし

#### 等表先(5)

化合物図は、化合物側と化合物図を作用させる ことによって製造される。

通常との方段は、アルリリ金属本界化物(例え ゼ本集化テトリウム、本業化のリウス等)やアル リリ土質金属水業化物(列夫技本業化ホルレウム 等)等の重型の存置下代行金われ、且つ一般別に は、リノテルムルムアミド変技术の他との反応に 温影響を手えまい整備中で行まわれる。反応量反 に倒接はなく、通常、帯炉下、室蓋下破技加蓋下 化素付金わる。

## 复意依(4)

化ら物向性化ら物向化化酸及び/叉は聚集水物。 例えば物度及び/叉は無水酔原を作用させること たよって得られる。との工機の反形は、無ペッダ ン化板アルッリ金属(例えば最高療法)トリウム、 最低機能ケトリウム、温板療能カリウム等)。 最高機能ケルリウ土限金属(例えば異素能・グネ レタム、温板原数カルシウム等)の他、有機能 (例えば甲板、参数等)・中級機能(例えば環接) 特期 昭55—11600 (21)

ては、集業及に収集等が含まれる。
この反応は、無機塩高や有機収高のかき塩高角 だ試験でルルコを実施、アルリリを経了ルコキナ イド、トリアルキルアミジ等の存在下に行なうの が取ましい。又この反応はアルコール(何大はメ メノール、エタノール等)変はその役立の反応に 影影像をがえない成集等の存在下に行なうのが 下だっていた高度に対象がなく、温を治力下 又は実施下に行さわれる。この反応にかいて、化 も物(7)の は、は、反応条件収は根拠高の機能によっては、他のカルボキンを根準を正実情される場合 があり、その根文ときも不発明の環節に含まれる。 自然を(1)

化合物(VE) は、化合物関をアミノ保護基の専 入反応化分するととによって得られる。

この反応は存在に使って行なわれ、アミノ高に 明入されるべきアミノ保護高がアドルである場合 だだ、方法1に述べた方法と実質的に同一の方法 で行なわれる。使って影響な観明は、<u>方法1</u>の実 を報告れたい。

等の数の存在下にかいて前手皮(進行させるとと ができる。

反応量度は制限されず、通常は加量下に行なわれる。

# 製造集(3)及び(7)

製造体例及び内は、<u>方依2叉は4</u>に示した様を 常依に使って行をわれる。

製造機関にかいては、反応条件化よって、だ。 を有する化合物、又は数だ。の代り化アミノを有 する化合物が製造され、それらは引き扱いて化合 物間又はその整備と反応され、製造扱いに示す機 にして、化合物(Bo)又は(Eb)が失く製造され る。

## 製造役的

化合物間の肝温数とは、一般的な散態、例えば 無機数に(例えば複数数等)、有機数能(例えば p・トルエンスルカン酸返等)である。数化合物 同の数を水工機化かいて用いるときは、通常、減 高例えば水散化アルカリ金属(例えば水散化ナト リタム、水散化カリラル等)の存在下状況からサト

特別 昭55-11600(22)

なうことができる。区形は、理常、水、アルッー ル(例えばノメノール、エメノール等)変はこの 区形の連行に居形等を与えない他の形成)等の終 機中で行えう。区が直便化制限はなく、通常は変 電下に行えう。

133

上記の各反応及び/叉は反応の使処産に参いて 上記互変再性体が他の互変再性体化変換されるこ とがもり、その様を場合もこの発明の範囲化合せ れる。

目的物質(I)が、4 世にかける避難をとして終られる場合、成は目的物質(I)が避阻のアミノを有している場合には、常体に使い、前記した様な框に 率くことができる。

目的物質(I) 及びその框架は全て新風な化合物で あって、高い抗糖品性を有し、グラム陽性及び除 性を含む広範囲の病尿袋生物の発育を組止し、抗 細数として有用である。

目的物質(I)の有用性を永宁為、代表的化合物の 試験管内拡張作用のデータを示す。 **灰敬化合物** 

(1) 7-(2-/トキレイミノ-2-(5-アミ ノ-1,2,4-サアヴアゾール・5-イル)アモト アミド)-5-(1-/ナル-1日-テトラゾー ル・5-イルウオノテル)・5・セフエム-4-のポン単(レン副が広)

2) フー(2-メトキレイミノー2-(8-アミノー12,4-サアジアソール-8-4ル)アセトフミドリー5-(1,5,4-サアジアソール・2-4ルサダメテル)-5-セフエム・4-カルボン

歳(シン異性体)

O) フ・( 2 - / トキレイミノ・2 - ( 5 - アミ ノ・ t 2.4 - サアジアゾール - 5 - イル ) アモト アミドリー 3 - ( 1 - ( 2 - アミノエテル ) -1 エ・テトラソール - 5 - イル ) サオノテル・3 - セフエム - 4 - タルポン数(ゲン具性体)

(4) 7 - (2 - エトキレイミノ-2 - (5 - アミ ノ- 1,2,4 - チアジアゾール - 5 - イル)アセト アミドリ - 8 - (1,8,4 - チアジアゾール - 2 -イル)テマジテル - 8 - セフエム・4 - オルボン

徴(レン異性体)

B) 7 - C 2 - メトヤレイ 2 ノ - 2 - (5 - T E ノ - L 2 4 - サアジアン ル・5 - 4 ル) アモトフェドリー 5 - C 1 - (2 - E F ロ + レエナル) ー 1 E - アトラソール・5 - 4 ル 3 テオノテル・5 - セフェエー 4 - カルボン酸 ( レン典性作 ) B) 7 - C 2 - J - L 2 4 - サアジアン ル・5 - 4 ル 3 7 アニノー L 2 4 - サアジアン ル・5 - 3 1 パット アニドリー 5 - C 7 アニノー 1 - 4 ル 3 アン リー C 1 - 4 ル 3 アン リー C 1 - 4 ル 3 アオノテル・5 - セフエム - 4 - カルボン酸 ( レン典性体 )

の) 7- C 2 - インプロボヤレイミノ・2- (8 - アミノ・1.2.4 - サアジアゾール・8 - イル) アセトアミドリ・5 - (1.8.4 - サアジアゾール - 2 - イル)サゴソテル・8 - マアエム・4 - カ ルボン酸(セン) 製物件。

(8) フェ(2-メトモンイミン・2・(5-アミノ・124-デアジアン・3・イル)プセト フェドリ・5・(1-デリル・18-テトラゾール・5・イル)テオメデル・5・イル)テオメデル・4・セブエム・4・ カルボン酸(シン具性体)

(9). フ・( 2・エトサレイミノ・2・( 5・アミ ノ・ L 2.4・サアジアゾール・5・イル ) アセト アミドリ・5・セアエム・4・カルボン酸(レン 異性体)

(10) フ・C 2・メトキレイミノ・2・(5・ア ミノ・1,2 4・テアジアソール・5・イル)アセ トアミドリ・3・C 1・(3・アミノアのビル) ・1 日・ナトラソール・5・イルリテオノテル・ ・・ロフェニュ・カルビン断(シン断体は)

# 試験方法

飲象物内抗菌品性を下記の東天平板希釈後によって求めた。

トリプチケース・ソーイ・プロス(商数10<sup>®</sup>級 /#1)中で一支海会した状態競技の一台全耳をハート・インフェージョン・アガー(EI-海突) に接載した。この場場には故園部が各級皮で合立 れてかり、37℃で20時度は毎した数乗低等下 数止級皮(HIC)を何定した。〈単位:#8/4/)

**特勝 昭55-- 1 1 6 0 0 (23)** 

本発明の目的化合物DIもしく社界等性の、震旋 学的化等も目得る塩を予防もしくは効果の目的で 役争する化的。では、動物質を主成分とし、これ 化医薬としてお思しうる環体、例えば低口、系低 口もしくは外別の有機もしくは加酸、関体主たは 救体の磁体を加えた一般的展別の形で投手される。 このようを製剤としては、カデマル、旋削、顕数 、軟膏。自動や回路体状製料、主たは液剤、顕 開解もしくは乳別等の破粉がある。そらに必要で もれば病形製剤中に補助剤として安定剤、振興剤 もしくは乳別等の破粉がある。そらに必要で もしばれる例、銀膏剤、その他乳別が即伸を 本質ながあたとすである。

化心物の依与量は年令、基準の状態、反射の機 臓、灰羊される心色の原葉はよって決められる が、一般的には19ないし6009の形で18 1回以上吹牛され、86代干井明には1間につ8 109、509、100号、250号、500号 及び10009の全で安牛される。

次に本発売原料の製造例及び目的化合物を得る 為の実施値を示す。

製造例1

t

5 - アミノ・リス4 - ナアジアゾール - 5 - カ ルボン数メナルの製造

17.8

8

=

:3

2

ŝ

=

ŝ

Party Harry

2

2

2 2 2

3 2 3

ន្ទ ន

â a

a | a

2 2

នឹន្ធ្រ

2

2

2 2 2 2

ŝ

313

23

3

FCC 6655

R

6

\*3

2

R

Ξ

ŝ

8

3

z

2

2

2 2 2

=

1・エトウレカルボニル・ホルスアミジン美数電(1649)の版本メタノール(843)旅版化、ナトリウム(1939)の版本メタノール(423) 旅版をもして加えた。この最も物化、美術(1289)の版本メタノール(423) 旅版をもして元夏に加え、得られた原因版化ナオレアン最カリラム(619)の版本メタノール(1003) 旅版を加えた。反応局も他を00で1時間区評し、完集で更になる時間が発した。反応局も物を400で1が第次で呼吸し、ご成本の概念との表が代表した。反応表も物を400で1が第次で呼吸し、戸版を監督機長した。段階を解像エナルと本の表彰に影響し、即版を工作を開発を加えて出る必要でデネレタトで発展した。前属を解表し、現版化路販エナルを加えてこれを第末化すると表面化

I.R(RP=-+): 5400,5250,5100,1710.

1610,1540as<sup>1</sup>

и.н.в.(e<sub>4</sub> -ризо) 8 : 3.85 (би.в)

825 (2H, s)

製造例2

る・ホルムアミド・1,2,4・サアジアゾール・ 5・カルボン歌メナルの製造

が他(539)と熊木弥像(229)の風合物 化5・アミノ・1、24・サアリアゾール・5・カ ルボン酸メナル(429)を加え、得られた現合 物を2日間弦磁で観響した。反応歌を被圧下に興 離し、ジエルエーテルとは「ハキテンの風合物 を残ぽに加えて砂水化すると、実態化合物(122 9)が得られた。mp 218-218で

f.E.(яУв—4) : 8100,1720,1680a=1 и.н.г. (44 - DMEO)

\$ : 890 (SE. .)

製造例 8

5 - \*\* ATEF- 8 - (2 - / + \* + \* - 2

- メテルスルフイニルアセテル) - 1.2.4 - ナア ジアゾールの知事

5 - \*\* AT : F - 1.24 - +TUTY-4 -B - カルボン曲メテル( 兄まり) とメテルメテル ナオメテルスルホテレド( 619 )をおお・ジ/ ナルホルムアミド(100㎡)に加えた混合物を 本省中で冷却しておき、これに50米太岩化ナト リクム(ストリ)を加えた。 歩みぬを実施で1時 衛援辞し、40℃にして更に1時間保持提係した。 変換まで冷却した反応長合物に塩化メテレン (300㎡)を加え、新出した沈原を俨取して塩 化メテレンで先歩した。そして意味(147g)、 本水(200m)及び塩化メチレン(200m) の現合物を微弊しつつこれに前記の比較を加えた 不務物を呼吸し、炉液から変化メチレン量を分離 した。この物液を無水保険マグネンナムで飲命し、 体薬を収去した。在所にジェチルユーテルを加す て粉末化すると、表題の化合物(45g)が得ら At. m. 150~1520

I.R.(メジョール): 3100,1680,1670m

7676 2455--- 1 1 6 0 0

8:222 )(58,2s)

2.28

268

2.85

580 (18.2s)

製造例 4

(3-ホルムアミド・1.2.4・ナアジアゾール・3-イル)ナオグリオキシル酸の3-メチルエステルの製造

3・山ルトアミド・3・(2・ノナルサオ・2・ノナルスルフイニルアセナル・1、24・サアジアソール(0.859)と飛び飛歌ナトリテム(0.29)の本際を(10 m)中最合物を、70で1.3分別件した。区の成分物から溶液を高端とせた数の機能で効果とかとよの機能に影響した。これに民衆水源ナトリテム水路域を加えて、557とし、サイ森数ナトリアム水路域で効果であって



た。有機器展開を分離し、無水磁像マグネシウム で発達した装置等低回した。投機化ジェクルェー アルと石油エータルの最合物を加えて等水化する と、変配化合物(260号)が得られた。mp 186~187℃。

J. R. (スジョール): 3100,1680,1660点「 M. M. R. (d<sub>6</sub> - DMSD)

> 8: 255 (88; s) 895 (18, s)

製造何5

2 - メントキシイミノ・エー(ラーホルムアミデー 1,2.4 - テアジアソール・3 - イル) 数数(ジン具性体) の製造

(8-ホルヘアミド・1.24-サアヴァソール ・8・ボルリナオグリオキレル酸の8・メチルエステル(251年)をパタノール(2元)と1歳 東京駅化カリア人水形質(3.5㎡)の民族に加え、 楽園で1時間保护した。民会物に1年返産服を加え 小田で1時間保护した。兄会物に1年でキセルナミ ン都発電(9.0年)を加えた景電で8.0分配 した。反応機合物に皮膚水滑ナトリウム水溶液を 加えで作性とし、メタノールを開発した。 動都さ れた水溶液を高板で pm 4 とし、原像エラルで洗 静した。水溶化塩酸を加えて pm 1 と リダム工能がしたを形像エチャで終出した。 始記 被を高級を関し、段級にジエチルエーデルを加え で毎水化した使炉取売滑ナると、実施化合物 (80回)水得られた。 mp 185~186 で。 L.E.(メリール): 5150,1726,1690㎡ FM FM L.E.(44-58160)

8: 378 (SH. .)

製造例 6

2・メトヤシイミン・2 - (5 - ホルムアミド - 1.2.4・ラアジケソール・5・イル) 貯蔵(シン具性休) 切製者

ちられルムアミド・5 - (2 - メテルテオ・2 - メテルスルフイエルアセテル) - 1,24 - テア リアソール(5,24)と選択来収テトリテム (0,87)の水路線(5,24)中最合格を7,0万 て45分徴終した。故郷を報会し、 株庫をゅっへ キサンで発摘した袋、メタノール(20m)とり 銀定水酔化カリウム水鉄線(40㎡)を加えた。 との節接を演集で1時間批拌した。反応売合物に 1集寮集除を知えて 明る とし、D・オナルヒド ロキシルアミン無酸塩(0968)を加えた静宙 業で1時間依押した。供給水素ナトリタム水液液 を加えて反応策を中加し、メタノールを留むした。 得られた太宗教を指摘エテルで先锋し、10岁数 む ナると、金襴教会体(Q99)が得られた。 no 東でp≡ 1とした後、塩化ナトリタムで他和し、 **御妻エテルで抽出した。 輸出療を無水産業マグネ** シタムで乾燥し、酢薬を留去した後の食迹だジイ ソプロビルエーテルを加えて粉末化すると、豊穣 化合物(1029)が得られた。 == 185~ 1860.

# 製造例7

...

2-1142427-2-(5-727-1,24 - ナアジアゾール - 3 - イル ) 酢酸 ( シン具体体 ) の製造

2 - 1 | ++ 2 | 1 | 2 - 2 - ( 5 - 4 ~ 4 7 2 F

で50分批押した。終備を撤去し、共復をモーへ キャンで洗涤した。機能に1規定水源化ナトリタ A 水溶液(160㎡)を加え、家様で1時間機能 1. 念。屋店最会物にローエテルにドロキシルプミ ン推動機(3.5 月)を加え、10半複数で9日 5 ~4 化銅雀した後、宮温で1 時間発停した。不能 集を記去した後、記載を勘慮エテルで洗浄し、 1 0 多塩酸で再びpま 1 化してから貯蔵エチルで 始出した。独出被を確康マグネシタムで乾燥し葉 発乾器した。長度化ジエテルエーテルとジイソブ ロビルエーテルの単合動を加えて粉末化すると、 2 - x Lav4 3 / - 2 - ( 5 - \* \* AT 1 F -1.2.4・チナジアゾール・5・イル ) 由級( レン 異性体)(459)が得られた。mp 165~ 1 6 8 ℃ (分無)。

1.R.(ADa-4): 3450,5170,5050,1780, 1690, 1595, 1565-1

H. M. R. (4, -DMSO)

8 : 1.50 (SH, t, J=7E:) 450 (28.4.1=784)

特明 IRISS-- 116 n n 1250 - 1.2.4 - チアジアソール - 5 - 4 ル ) 救助(レ ン異性体)(しょり)の1単定水酸化ナトリタム 水液節(191㎡)中蔵鏡を50~55℃で1時 能加熱した。この最会被を本鉛中で冷却しながら、 とれど単位的(19㎡)を加えた。最高級を選化 ナトリクムで集和した着、路井エチルで輸出した。 輸出液を無水産業マグネレタムで軟備し、高発剤 **聞した。 神体ビジェチルスーテルを加えて鈴文化** 180~182℃(分解)。 1.R. (RP=---) : 3450.5250.3100.1715.

1410 15500

H . M . R . ( d4 - DMSO)

8: 3.90 (88.4)

810 (55. brend a )

## 製造例 8

5 - \*\* \* T = F - 5 - (2 - / + \* + \* - 2 - 1 + N × N × 1 = N × + N ) - 124 - + T ジアゾール(108)と選択常康ナトリウム (2.8 月)の水田県(50㎡)中民会物を70℃

## 6.87 (18.0)

## \*\*#

製造例8と同様の方法だよって下記の化合物を

(1) 2 - 70 # 4 V 4 3 / - 2 - ( 8 - \* N A 7 ミド・L24・ナアジアゾール・3・イル)印象 (シン具性体)、mp 168~178℃(分解)。 1.R.(x20-0) 1 8250, 8140, 1720, 1690,

# 1590.188041

N.M.B. (4, -DHSO)

8 : Q90 (8H, 1, 3-6H1)

14~19 (2E.m) 417 (2E.t.J=68s)

885 (18.0)

B 2-4770845421-2-(5-#N AT : F - 124 - FTVTY-N - 5 - 4N) 奇敬(シン共位体)、mp 180~1点2℃(分 無)。

1.E.(x/a-+) : 3280,1720,1690,1590, 1530-1

N.M.R. (4, -DMSO)

8: 125 (68,4,3=68\*) 42-47 (18,m)

(0,0)

# 製造例10

2-エトキレイミノ-2-(5-ホルムアミド
-1・2・4-テアジアソール-3-イル)歌響(
(ナン県佐体)(4-4月)と1 製売金 (ナトリウム水溶液(5-4ms)の場合物を50 -55°0で2時周維持した。現合物を未込中で 冷却し、塩物(5-4ms)で砂弦をした後、誘調 エチルで抽出した。抽出液を破却マグネシウムで を加えて粉水化すると、2-エトキレイミノ-2 -(5-アミノ-1・2・4-デジアソール-5-イル)動物(ジン典性体)(2・2・1)が係 られた。即168~1700(分解)。 1.B.(スジョール):5450(5-450・6570・

8250 8150

1580 cm-1

N.M.E. ( d<sub>6</sub>- UMSO ) 8: 1.22(5H: 1: J=7H:):4.17 (2H: 0: J=7H:):8.17(9H: brosd s)

#### BEN11

製造件10と阿様の方法によつて下配の化合物 を製造した。

(U) 2-プロポキレイもグー2-(5-アモノ -1・2・4-チャダアソール-6-イル)助歌 (ビン男技体)、mp'100-108\*0(分析) 1.第(エジョール): 6620・8520・ 8560・5120・ 1720・1620

# N.M.B. (d.-DM8O)

1650 cm

(は) 2-イソプロポキレイもノー2-(5-ア もブー1・2・4-デアロアダール-3-イル) 動動(レン異性体)、mp 152~155\*\*\*(分 #)。

16 ST 4 ST

1620 · 1580 em-1

N.M.B. (da-DMBO)

.

8: 1.22(6H· d· J=6Hz)· 4.14.6(1H· m)· 8.20(2H·

## 製造例12

7-アミノセファロスポフン酸(14.81f)、
5-アリルナオー1・8・4 ーサアジアゾールー2
ナオール(14f)、炭酸水漬ナトリウム(
10.6f)、水(85mil)及び対 6-4の廃散 販売減(105mil)の混合物を65~70℃
4時間提持した。反応混合物に開催レネ・が150 mil)を加え、水酸でり以るに開催した。対比物を が取し、水、メタノール及びマオンで洗浄した 収乾力すると、振顔のフーアズノー3・(5・ア リルナオー1・5・4 ーナアジアツールー2・1 ル)ナオメナルー8・セフエエー4・カドボン酸 (15.4f) が新潟内角を伏す他られたこの節 特別 明55-11600 27) 来(101)セメディール(100m1)と典性 第(70m1)の展版に静野した映浄地し、炉 膜を衝眩異で処理した映アンセニア水で辿る に開催した。静酔エテル(50m1)を加え、 比酸物を呼取し、水及びアセトンで洗浄した映、 配射すると、純品の自物質(5.21)が得ら れた。mp 195-1970。

1.E.(メリョール):8150・2700-2500・7550
1800・1610・1600・720
-1510・1040・720

## 製造例16

(3) 当一(5 ーメトキルアロビル)ジチョカ ルパミン酸メチル(100.2 月)のエタノール (500 回 4) 海根を、ヒドラジン水和他( 28月)のエタノール(200 m 4) 海根火、 5<sup>10</sup>で50分を被して面下した。との総合他を 70<sup>10</sup>で4.5 時間接針し、海部した後、水とジ エナルエーテルを水に加えた。ジエナルエーテ 州油出版を経験マアキャラムで発動し、滅圧下

に重発能闘すると、熱色摘状の4-(δ-メトキ シアロピル)チオセミカルパジド(89.91)が 得られた。

# N.M.B. (CDCs, )

8: 1.87(2H· m), 8.88(8H· s),

81. 7.8(4H, broad 8)

(B) 4-(8-メトキシブロビル)テオモミカ
ベバジド(89.9 月)と平静(450mi)の成 合物を1050で8.5時間限度依頼やした。被圧 化学を留会し、機能に耐象エナル(800mg) と水(200mg)を加えた。分類した有限服を 5分減齢水素ナトリッム水溶板で洗浄し、更に塩 化ナトリッム水溶板で洗浄した吸吸酸マグラシッ が得られた。これに水敷化ナトリッム(26月) の水(260mg)及びメタノール(40mg)静板 を加え、執圧下にメタノールを留ました。機能に 水(100mg)を加え、100%塩等で到る火 に関数した。機能である。100%塩等で到る火 を加え、減圧下にメタノールを留ました。機能に 水(100mg)を加え、100%塩等で到る火 に関数した後、静度エナル(150mg)を に発動とした後、静度エナル(150mg)となる に関数した後、静度エナル(150mg)となる に関数した後、特殊で到る、100%塩等で到3×2mg) で抽出した。抽出版を保険マグキャウムで乾燥し、 海線を留実すると、機色油状物(40.82ま)が 得られた。本品をシリカジル(500 日)のあおフ ムグロマドグラフで搭載し、海像エナルで用出 ると、抽状の4~(5 ル・トキンプロピル)-4 耳-1、2、4~トリアゾール-3~チオール( 8.95ま)が得られた。

N.M. B. (CDCg.)

8: 2.14(2H, m) 5.40(8H, e),
8.47(2H, t, J=7Hz), 4.18
(2H, t, J=7Hz), 7.94(1H,

# 製造例14

**袋原 〒55--- 11600 (28)** 

む母会物化、日~5℃でる5分を要し沃化メナル (1791)を加え、反応混合物を料準度でる時 顔接機した。途圧下にジオキサンを留去し、残後 \*\*\* 200 md + 200 md × 4) て抽出した。抽出板を延載マグルシウムで算量!... 雑圧下に暴崩すると、抽状のN-(るってもして ミドプロピル)ジャオカルパミン酸メチル( 193.1851#4644.

.0:

(2) おー(るーフセトアミドプロピル)ジテオ カルバミンサミナル(1958)のジオキサン( 610mg ) 準度とナトリウムアジド ( 79.42 # )の★(500mt) 施修の場合施令 4 時間書 技機棒した。ジオキテンを留去し、残留水層をジ エナルエーテル(150mt×2)で作論し、 17.5 必集曲での以1に開催した要素が中で冷却 1.4、前品を形面1.女女で売換すると、白色祭束 はの1-(ムーアセトアミドプロピル)- 1 基-テトラゾールー5ーチオール(91.758)が得 5 h.t. mp 152~154℃.

N.M.B. (d,-DMBO)

提板中に加えた藤波に、生み機井下加えた。次い でとの長合物を施温で1.7.5時間接券した。ジェ キサンを留去し、残捨化ジエチルエーテルと少量 の水を加えた。新とう後水がを分離し、有事値を 10分炭酸カリウムで2回抽出した。抽出度を免 の分離水油と合し、ジェテルエーテルでる資産機 した後、塩象では、とした。 ジェナルエーテルで 抽出して抽出液を水洗し、減圧下に毒機を留去し ナ。英語放け他(10.9つき)だびイソデロビル エーテルを加えて着水化すると、1~0五~海 8 - 寒る鏡ブトキシカルポニルフミノ)プロピル) - 1 H-ナトラゾール-5-ナオール(9.61) が得られた。 mp 75~ 77℃。

I.B. ( x 5 = - r ) : 8 8 8 0 · 8 2 6 0 · 1650 . 1580 .

1170 - 1050 cm-1

## N.M. B. (CDOg.)

# : 1.50(9H. '0). 2.14(2H. m). 5.25(2H. m): 4.59(2H. s. J=7Ms) . 4.9-6.7(1M. broad) # : 1.87(5E+ #)+ 1.97(2E+ m)+ &.17(2以· m): 4.28(2以: 1: Jan7Hx) . 7.9(1H . broad s) . 45.B(4H, bread a)

1 - (A - 7 + ) 7 & F 7 P C # ) - 1 H -テトマゾールーちーチオール(858)と6単字 塩酸(18)の混合物を75分間複単量性した。 反水系会物を減圧下に暴除し、沈微物を尹取して ヘルサンラバジェチルエーテルで売換すると、 1 - ( - アミノプロピル ) - 1 耳-テトラゾール - 5 - ナオール塩酸塩 ( 6 7・1 5 ま )が得られた。 N.M. R. (D.O)

# : 2.45(2H. m). 8.25(2H. t. J=7Hs) · 4.50(2H · s · J=7Hs) (4) 2 - 第る級プトキシカルボニルオキシイミ J-2-715NT+1=14N(12.51)0 ジオキサン(SGm& ) 務故を、1-(るっても ノプロピル)- 1日-テトラゾールー5-チオー ル塩砂堆 ( 9.7 8 0 ) とトリエチルアミン ( 11.1 ま)モジオキサン(25mg)と水(25mg)の

#### **多油条15**

(1) 5-ナミノー1・2・4-ナナジナゾール ーるーカルボン酸メナル(261)、最後酸( 4 9 D m4 )及び少量の個からなる混合物に、-10~~15℃で40分を終し、 乗勘費ナトリ サム ( 2 2 · 5 1 ) の水 ( 2 8 m4 ) 藤椒を添加し た。反応配合物を開業度で1.5時期提件し、50 ♥ で 5 日 分接件 した。 反応提合物を本水( 5 日 日 md ) に注ぎ、動歌エナルで輸出した。 輸出版を 洗券し、乾燥装器がると、白色粉末状の5-ク ロロー 1 ・2 ・4 ーチアジアゾールー 6 ーカルボ ン胆メナル(8.91)が得られた。

1.8. (メジョール): 1780 - 1480 -1 4 8 5 . 1 4 2 0 .

1990 . 1046 .

984 · 850 cm-1

#### N.M. H. (ODOA.)

- # : 4.01(88. s)
- 5-000-1·2·4-+7574-A

( 5.52 f ) . + + 7 t F = 7 7 × ( 2 4 ml ) 及び水(8m)の単合物を 6.5回燃をかやかに 排縢した。反応混合物を常法に従つて処理すると、 音色発安状の5ーメルカプトー1・2・4ーチア ジァゾールー5ーカルボン豊メチル(7.11)が 傷られた。 mp 126~127°C。

I.B. (x5=-w):1780 - 1480 -1840 - 1970 -

1 0 4 D and 1

# N.M.B.(d\_-DMSO)

8 : 5.91(AE, s): 9.85(4H, m) 製造例16

(1) トリクロロメチル発音をノグロルド (88.58 8)を2-アリルイソナオ級需要化水素験塩( 95.61)の水(285ml)離級に0℃で加え、 水酸化ナトリウム(768)の水(800mg) **掲版を4時間に亘つて抽券したがら終下した。1** 時間推荐した後、反広原会施を常法に臨じて株式 埋すると、赤褐色油状のる-アリルチオー5-9 --- 1 · 2 · 4 - + 7 5 7 7 - \* ( 8 4 4 ) \*i

特開 昭55-11600(29) bp 1 6 5 ~ 1 1 1 0 / 1 5 mHg. 1 8 7 C om-1

N.M. R. (CDC4.)

# : 5.90(2H. d. J-AH.). 5.15 -5.47(2H: m) · 5.67-6.54 (1H.m)

(2) A-TUN++-5-000-1.2.4 - ナアジアゾール( 1 5.0 1 )、ナオ最素 (6.95 まり、チドラヒドロフラン(A.S.m.t.)及び水く 1 5 mℓ ) の原合物を8.5時間65℃でかだや **水が集動させた。原水系会動を常井により集体器** すると、粉末状のるーアリルチオー1・2・4-ナアジアゾールーちーナオール(8.5g)が傷ら nt. mp 107~108℃.

1.8. (ヌジョール):1510・1450・ 1170 - 1095 -9 0 0 000-1

(I) N-(2-74/プロピル)アキトアミド

(82.91)ロジオキサン(415ml) 高値を 9 7 多水酸化ナトリウム (29.5 1) の水( 550 四4 ) 遊艇中化加之、更化2硫化炭素(54.5%) を0~5℃で25分を祭して勝下し、同温度で1 時間接換した。これに折びるチャ(101.5 g) をリーる℃でる日分を築して裏下し、両温度であ 時間操弊を続けた。反応混合物を最齢し、動使至チ ル(200mg×1、100mg×2)で抽出し た。 抽出液を破除マグネシャムで参唱!.. 出出な 留去すると抽状物(164.2 月)が得られた。 これをシリカゲル(9001)のカラムクロマト グラッに連絡し、ベンゼンと影響エチルの混合物 (1:1)及び酢酸エナルで排出すると、別ー( 2-7キトアミドプロビル ) ジチオカルバミン田 メチルとガー(1-(アセトアミドメチル)エチ ルンジナオカルパミン酸メナルの抽状混合物( 114-11) が得られた。

1.8. (機能): 5400-5200・1780・ 1670-1660 .

1560-1500-1510-

1280 - 1250 -1150 · 940 cm"

(2) M-(2-アセトアミドプロピル)ジチオ カルバミン節メチルとがって 1~(アセトアミド メナル)エチル〕ジナオカルパミン酔メチルの昼 会飾(100g)をジオキサン(A00mg )にか え、これちとナトリウムアジド(411)の水( 27日叫4)溶液との混合物を4.5時能維料療法 した。禁圧下に反応機合物を約半量まで装飾し、 ジエチルエーテルで洗浄した後、最塩象で酸性に した。新出物を辞取しジェナルエーテルで先巻十 ると、1-(1-(ブセトアミドメチル)エチル 1-14-テトラゾール-5-デオール (24.52 ま)無装黄色粉末として得られた。mp 176~ 178°C.

I.B. (メジョール): 5420 · 2850 · 1640 - 1550 -

1520 - 1890 -1 5 5 0 . 1 5 1 0 .

1210 - 1050 -

特別 昭55--11600 (30)

- ( 1 - ( T 1 / 1 + N ) = +N ) - 1 且ーナトラゾールーちーナオール塩膏塩(178) トトリエチルフミン(19.551)の50労水性 ジャルサン(89mg )海液に、 2~第五級プト キシカルボニルオキシイミノー2-フエニルアセ トニトリル (21.41) ロジオネナン (50 104) 準確を支着冷却下に加えた。反応患会物を宣義で 1.5時間接押し、次いで「企業難した。水帯液を ジェチルエーテルで洗浄し、洗練を装御カリウム の水準度で再始出した。2つの水準液を合し、ジ エチルエーテルで洗浄した後、昏瞀エチルを加え た。との混合物を10%塩酸で酸性とし、有機剤 を分離した。とれを硫酸マグネシウムで乾燥した 後、業務撤退し、機技化ローヘキサンを加えて粉 女化すると、1~(1~((ガー筋を設プトキシ カルポニルフミノ ) メテルトエテル ) - 1日 - テ トラゾールー5ーナオール(19.15 ៛)が得ら

1.B. (\*\*\*-\*): \$270 · \$070 ·

nt. mp 156-158℃.

990

121

N.M.B.(d<sub>8</sub>-DMSO·8): 1.40(3H·4·Jm 7H::-1.75(3H·s:)-5.51 (2H·s:)-4.91(1H·s:)-8.00(1H·6·J-6H:)

(3) 1-(1-(アセトアモドメテル)エナル)-1月-アトフザール-5-テオール(第 f)と6 現実協康(800mf)の既合物を模件では2時間最後し、次いて重角範囲した。機能でジェナルエーナルを加えて粉末化すると、1-(1-(アセノメナル)エナルエーカーナス・アルコー1月-テトフゾール ロ 208-210℃。

1.B. (メジョール): 2800-2400・ 1610・1510・ 1285・1200・

N.M.E.(U<sub>2</sub>O+8) : 1.62(5H· d+ J=7Hx)+ 6.70(2H· m)+ 5.25(

1550 · 1500 · 1590 · 1540 · 1500 · 1180 · 1180 · 1180 · 11040 cm<sup>-1</sup>

N.M.B.(d<sub>s</sub>-цмво, d): 1.40(9H, s), 1.52(8H, d, J=7Hs), 8.41 (2H, m), 4.95(1H, m),

## 安施伤1

7-(2-メトルレイエノー2-(5-ホルト
アミドー1・2・4-サフジアソール・5-イル
アミドー1・2・6・(1-メナルー1出-アト
フゾール-5-イルナオメナル)・5・セフエエー
4-カルボン酸(レン美性杯)の関節
以、パージメナルホルムフミド(6 mg)とオ
アレ塩化病(9 18 mg)の混合物を強弱で50
分散所し、たれて塩化メナレン(6 mg)と2メトルレスノー2-(5・ホルムフミドー1・
2・4-ナブジアゾールー5-イル)酢酸(セン
最後に1、1・1)を-15-10でな出え、同

単度でる0分後許した。フーアモノーるー (.1-メチルー1以一ナトフゾールー5ーイルチオメチ ル)ーカーセフエムー4ーカルボン数(1・9.7 !) ととリメテルシリルフセとアモド ( 6 ま ) の母合 物を堪化メチレン(.60 mg ) に加え加盛すると 登明な藤原になつた。」との春度を一15℃ に冷却 し、先に得た階級中に加えた。反応要合物を B™U で1時能操并し、炭酸水素ナトリウムの冷水溶液 中に住いだ。水道を分離し、10%塩酸で 円2 に開整した後、静樹エチルで輸出した。始出版を 無水硫酸マグキシウムで乾燥し、高発乾燥した。 務後にジェナルエーテルを加えて粉末化すると、 劉彪の表職化会物(2.751)が得られた。これ を謝御水楽ナトリウム水路磁化溶解し、新塩散を 加えて再次酸させると表態化合物の範疇(1.5 f) が得られた。 mp 170-175℃ (分解)。 I.B. (###~#):5500 · 1780 ·

N.M.R.(de-DMBO #): 5.90(2H broad #1. 5.95(8H #): 4.00(8H a), 4.55(2H· broad a), 5.17(1H· d· Jm4Hx), 5.87 (1H· 2d· Jm4, 8Hx), 8.85 (1H· s), 9.70(1H· d·

## 夹单例 2

韓開 昭55─ 1 1 6 d a (81) 1 # × + ~ × 5 ~ 7 \* 1 7 \* F ( 0.9 # ) O# 化メナレン(9m~)中最合物を加銀すると差明 な搭款となつた。この混合物を本鉛中で冷却し、 上紀で得た感放中に加えた後、□℃でる□分娩が した。反応混合物を、炭酸水素ナトリウムの冷水 幕隊に住ぎ、水籠を分離し、10%地勢で1日! に開業した後、影響エチルで抽出した。抽出液を 無水硫酸マグネシウムで乾燥し、麻発乾燥した。 機嫌にジエチルエーテルを加えて粉末化すると、 祖朝の表版化合物(120m~)が得られた。と れを炭酸水素ナトリテム水路液化溶解し、番塩酸 を加えて存む数させると、表頭化合物の無品(40) mf ) が得られた。mp 170~175~ (分解)。 I.B. ( ##=- #): 5500 · 1770 · 1660 . 1610 .

1520 ----

M.M.E (dg-DMSO. 8) : 5.75(2H. bread s).
5.97(6H. s). 4.55(2H. bread
s). 5.15(1H. d. J-MAHE). 5.85
(1H. 2d. J-4. 8.5Hz). 5.15

(2H· s)· 9.57(1H· d·

#### 突施供る

フ・〔ユーメトキャイモノー2 - (5-7モノ -1・2・4-ナアジアゾールー5-イル)ナセ トフモド)セフアロスポラン妻(ナン属性体)の 製造

2 - メトキシイミノー2 - (5-マミノー1 ・ 2 ・4 - ナフジアゾールー5 - イル) 助助 (シ ・ 4 - ナフジア・ファック ・ 5 - ナフェア・ファック ・ 5 - ナファック ・ 5 - ナファック ・ 5 - ナファー・ファック ・ 5 - ナファック ・ 5 - ナファー・ファック ・ 5 - ナファック ・ 5 - ナファック

me 、 p以 7-8)を分離し、これに静御エナルを加えた。との現合物に10年後かを加えて加して 不を加えた。との現合物に10年後か起した 不能物を始ました。静御エナル屋を分離し、設備 マグネシットで乾燥した装滞施を留ました。 別様 にジェナルエーテルを加えて粉水にし、根膜のサ 能化合物(2.41)を得た。 本品を収削 ホボナト リウム水溶液に溶解し、活性炭(100m4)で 処理した装、10年進齢で料22とした。 折出物 を呼取し、本本で洗浄した状態すると、表態化 合物(1.21)が得られた。mp 180~185 で10分割)。

. 5550 - 1780 - 1780 - 1780 - 1780 - 1780 - 1680 - 1620 - 1550 - 1620 - 1550 - 1620 - 1550 - 1620 - 1550 - 1620 - 1620 - 1550 - 1620 - 1620 - 1550 - 1620 -

H.M.R. (4,-DMSO - S): 1.97(5H - s).

5.50(2H - s). 5.87(5H - s).

(4.67 (2H - ABq , J=14Hz).

5.08(4H - d - J=4Hz). 5.77

2

(1H. 2d. J=4. 8.5H=). 8.06(2H. =). 9.50(1H. d.

## 安装务4

フー(2-メトキレイミノー2-(5-アミノ -1・2・4-サブジアゲールー 5-イル) ギエ トフミド) - 5-カルパセイルオキシノナルー 5 - セフエム - 4-カルボン節(セン異化体)の観

2・4・チャンイミノ・2・(5・アモノ・1・2・4・チャンファソール・5・イル) 節数(2・2) 監接・1・0・1 月・2 オャン単化病(5・0・6) の数化メナンソ(2 5 mg・) 中暴合物を質量で2 時間横搾した状、0 つに冷却した。これにお・8・ジスナルルルエフェド(2・0 mg・2 か立え - 3 ー カルバセイルオヤンオナン・5・セフェス・4・カルボン酸(4・9 ま)とトリメチルショルアセトフェド(1 1 月 )の数化メチンソ(1 1 月 )の数化メチンソ(5 1 1 月 1 1 0 mg ) 中央会社を用出、1 1 1 5 0 1 に か

特別 別55-11600 (Q2) 助してから上記で得た降級に加え、0°0°でも0分 使計した。反応会争を決議し、これに参考エトリットの元。水屋を分離し、これに参考エトルを加えた、得られた是合物に10%塩酸を加えてり以2とし、不締物を野虫した後、塩化ナトリットで急かした。参考エチル屋を分表し、品数をパンチルエーナルを加えて粉末化し、粗酸をパンチルエーナルを加えて粉末化し、粗酸をパンチルエーナルと加えて粉末化し、粗酸をパンチルエーナルと加えて粉末化し、粗酸を脱れる物(1.2 月 を得た。これを開除水煮ナトリット水路板に増加し、10%塩酸を加えておた。これを開放し、水路板を増加えてお、表現化合物(0.55) が得られた。即190°(4) (4) が得られた。即185~190°(4) (4) 1000

1.k. (x2 m - w): 8 8 5 0 · 17 8 0 · 17 8 0 · 17 2 0 · 16 8 0 · 16 2 0 · 15 8 0

N.M.B. (d<sub>8</sub>-DMSO 8): 5.52(2H· s).

5.92(3H· s). (4.62(2H· ABq.

J-12(H· ) 5.14(4H· d· J-2HR).

5.80(1H· 2d· J=4· 8Hs)· 6.58(2H· 0)· 8.10(2H· 0)· 9.54(1H· d· J=8Hs)

## 安集例5

7-(2-メトキシイモノー之-(5-アモノ-1・2・4-テアジアゾール-3-イル)アモトア エド)-2-メテル-3-モフエム-4-カルポン ■(セン最後体)の製造

2・1トキンイミノー2・(8-フミノー1
2・4・チアジすゲール・8・イル) 静原(レン
現物件: 1・2・1 ま)とよキン単化(例 (8・6 プ ま)
の塩化メナレン (80 叫 ) 中現合物を、 質量で
2時間標件した後0°でに方がし、これだが、 メー
ジメナルかルムフミド(2・4 叫 ) 予ま ガーニン・ス・ノー
アルー 8・セフェム・4・カルボン酸(5・0 ま)
とトリメナルシリルフェトド(10 ま)の塩 化メナレン (5 0 叫 ) 中総合物を加益して 選択
ポポルン・(5 0 叫 ) 中総合物を加益して 選択
ポポルン・(5 0 叫 ) 中総合物を加益して 選択
ポポルン・(5 0 叫 ) 中総合物を加益した 変形機 他を契修水ネナトリウムの冷水溶液中に加え、水 源を分離した狭へ勝勝エチルを加えた。との混合 物に10%素素を加えて同立とし、助産エチル 産業的で加水底線マグネンウムで発動した技、 溶板を御ました。接接にジェナルエーナルを加え であったすると、弧質の姿態化合物(2・2 f)が 待られた。本品を資素水果ナトリウムの水溶液に 溶解し、10%集像で呼互とした。 新出物を炉 及し、本で化作した狭成像すると、実質化合物 (1.6 f) が得られた。mp 175~180°C 分解)。

1.8. (メジョール): 5850 · 1775 · 1675 · 1650 · 1580 · mm<sup>-1</sup>

M.M. A. (d<sub>3</sub>-EMSO - θ) : 1.45(8H - d - J<sub>-6</sub>KE<sub>2</sub> ) 5.6-5.9(1H - m) - δ.95(8H - θ - S.07(1H - d - J<sub>-6</sub>KE<sub>2</sub>) - δ.87(1H - d - J<sub>-6</sub>KE<sub>2</sub>) - δ.87(1H - 2d - J<sub>-6</sub>KE<sub>2</sub>) - δ.55(1H - d - J<sub>-6</sub>KE<sub>2</sub>) - δ.55(1H - d - J<sub>-6</sub>KE<sub>2</sub>)

#### J-AR x )

# 実施例も

フー(2-メトキャイモノー2-(5-アモノ -1・2・4・テンジアゾールー3・イル)アセ トアモド)ー 5-セフエム - 4・カルギン酸ー4 ニトロペンジル(レン異性件)(1)及びフー (2-メトキャイモノー2-(5-(Wー/N・ジ メテルアモノメテレン)アモノ)-1・2・4ー ナブプアールー5-イル]アセトアモド)ー5 セフエム - 4・カルギン酸ー4ーニトロペンジ ル(レン異性件)(1)の酸的

2-メトキャイミノー2-(5-アミノー1・2・4-ナアジアソーが35-イル)動像(ピン 現在件:1・21年)とオャレ製化(解(5-67年)) の塩化メナレン(50両4) 中最合金を重量で2 時間接押し、0で化作明した級、N・H・ジメチャルムフミド(2・4両2)を加え、0で化かいて更に45分便押した。7-アミノー5-セフンル(2・68年)とトラメナルセリルアホトアミド(8 韓間 昭55---11600 (23)

の1 Bスペクトル及び料盤 Bスペクトルを示した。 1.B. (メジェール): 8 8 0 0 ・ 1 7 7 0・ 1720・ 1 6 7 0 ・ 1 6 2 0・

1510 cm-1

N.M.R. (dg-DMSO - 3) : 5.65(2H - broad

終出すると、はじめに表態化合物(1)が得られ

(1.0 f)、mp 150~155℃、 数の方の

mp 1 1 5 ~ 1 2 D℃。 遊報化合物 ( 1 ) は下配

公園からは事業化会物(Ⅱ)が得られた(1·11)。

5-17(14-d-Jm44x)・5-45
(24-s)・5-92(14-24Jm4-9Hx)・6-67(14-tJm5Hx)・7-70(24-d-Jm6Hx)・8-08(24-s)・8-28(24-dJm8Hx)・9-55(14-d-Jm9Hx)・
表現た合物(日)位下記の1ホスペットル及び
NM ホスペットルを示した。

1610 om-

I.B. (メジョール): 8800・1770・ 1720・1670・

N.M.B. (d<sub>a</sub>-IMSO. 8) 2 5.87 (EE. 2).

5.20 (EE. 2). 5.65 (2H. 5).

5.17 (1H. 6. Jacks.) 5.45 (2H. 2).

5.57 (1H. 6. Jacks.) 7.70 (2H. 6).

6.67 (1H. 6. Jacks.) 7.70 (2H. 6).

4. Jacks.) 8.25 (2H. 6.

Jacks.) 8.47 (1H. 2). 6.60 (1H. 6.).

## 突旋例7

2-21+2151-2-(5-711-1: 2・4ーナアジアゾールームーイル)酢酸(シン **異性体:1.5 !) とオキン塩化費 ( 5.6 ? ! )の** 塩化メチレン( 8 0 ms ) 中混合物を 宝温 で 2時 間機券し、次いで−12~−15℃に冷却した。 CRESSENANATER (2.4 mg ) +ms. -8~-10°0で45分標件した。一方7-アミ 1-5-(1.8.4-+7277-2-2-4 か)ナオメナルー 5 - セフエム・4 - カルボン酸 1)の塩化メテレン(40 mg)溶液中混合物を 加暴して悪視とした。との感覚を一25°C に糸却 し、上記の特性混合物中に加えた。反応混合物を -8--10℃で50分機棒し、炭粉水煮ナトリ ウムの治水帯後中に住いだ。とれを放量でる日分 権持し、太閤を分離した。太閤に10%均能を加 えてpH 1とし、御歌エテルで抽出した。抽出液 を異律マグネシウムで乾燥した後葉発乾尚し、残 旅にジエテルエーテルを加えて粉末化すると、粗

特階 昭55-11600(34)

間のフー(2ーエトキシイミノー2-(5-ァミノー1・2・4-テフジアゾール-5-イル)フ キトフミド)-5-(1・5・4-テフジア ルー2-イル)テオノテル-5-セフエム-4-カルポン酸(シン異性件: 2・6 ミ)が得られた。 これを設備水滑ナトリウム水溶液に溶解し、10 多塩酸を加えて再比酸させると、最的物質の積品 (1・9 2 ミ)が得られた。mp 15 0 - 15 5 ° (分解)。

分所)。 1.B. (メジョード): 5550 · <del>2250</del> · 1775 · 1680 · 1620 · 1580

N.M.B. (d<sub>g</sub>-DMBO , d) : 1.27(5H. s. J=7Hz) : 5.72(2M. broad s). 4.22(2H. q. J=7Hz) 4.52 s.L Of 4.55(2H. ABq. J=18Hz).

> 5.17(1E. d. J=5Hs). 5.85(1H. dd. J=5 s. L (F.8Hs). 8.15(2H. broad s). 9.56(1H. d. J=8Hs).

夹施伤 8

2-1770442181-2-(5-75) - 1・2・4 - チャジナゾール- 5 - イル ) 助命 (タン集物体: 1.5.8.5.) トナカシギの株 ( 5.47 1 ) の本化メチレン( 5 D mat )中原会的を 東郷 で1.5節無接券1.. 更に-12~-16℃ナアみ #1.\*. \* を加え、-8~-10°Cで45分操件した。他方 7-717-5-61.8.4-+7077-2 -H-2-4-1++++-3-+7-4-4 - カルボン町(2.9 !)とトリメナルシリルでも トプミド(81)の塩化メチンン(40mt)中屋 合物を加盛して溶液とした。とれを−25℃に冷 如 L. 先忙唱光云性观会物化加えた。反应观会物 を一10℃でる0分機券し、炭像水井ナトリッム の冷水帯限中に住いだ。集合物を窒息でる日分権 押し、水間を分配した。水間に10分均間を加え て5年1とし、静原エチルで抽出した。 抽出液を 延設マグネンサムで乾燥し、寒発乾燥した。接法

にジェチルエーテルを加えて粉末化すると、私質の7-(2-イソアロポキシイミノ・2・4・チンプアソールー3・イルフェトフェリー5・インフェーイ・2・4・チンジアソールー3・インリティール・フェー4・リティール・カーボー3・ボース・イーカルボン側(ピン具性体: 2-25 f)が得られた。本品をアセトンと翻訳エチルの見順に序除し、アセトンを観ました。折込物をアルフェと上記的リウムの水準硬に溶解した後、10 6 3 m を加えて 子比側させると目的物質の構造(1-25 f)が振

1.B. (xym-w): 8570 · 5280 · 1780 · 1680 · 1680 · 1625 · 1580

N.M.R. (d<sub>4</sub>-DM9O · ): 1.25(dH · d·J=dH2) · 5.68(2H · broad · ) · 4.2-4·6 (1H · m) · 4.28 » L U · 4.55(2H · d·J=dH2) · 5.15(1H · d·

J=5Hz). 5.80(1H. dd. J=5 > 1 (F 8Hz). 8.12(2H. broad s). 9.50(1H. d. J=8Hz). 9.55(1H. s)

央旅例?

5 塩化鼻(250mf )と塩化パチャンン(5 md)
の混合物を重量で10分換件した。これに、一切
つて2-インプロボセンイもノー2-(5-7
もノー1・2・4ーテアジアツールー3-イル)
動像(シン基位体:250mf)を加え、一切
~一15つで45分娩件した。アーアモノキフアロスポテン酸(350mf)とトリメチャンミルフェスポテン酸(350mf)とトリメチャンミルアセト15つで生かれた加え、一10つでもから効果がした。反応混合地に関サボルナトリウムの機能した。大脚に関サンス・サンを加え、200mf)の一個で10年間に関サンス・サントを開発した。 施田板を駆けてグランス・サロデーを対した。 施田板を駆けてグランス・サロデーを対した。 施田板を駆けてグランス・サービを開発した。 機能板を駆けてグランス・サンス・競した表現した。 機能板を駆けてグランス・サロデーを対した。 機能板を駆けてグランス・サンド 動物で

えて粉水化し、とれを炉板すると、7-(2-4 ソプロポキレイミノ-2-(5-7ミノ-1・2・ 4-チプブゾール-3-イル17セトブミド) セフプロスポラン糖(レン異性体:450m) 1.8.(スジョール):8500-1780-1725・

N.M.R. (d<sub>a</sub>-DMSO、 b) : 1,80 (dH. d. JmdHz). 2.08 (dH. s) 5,62 (2H. broad s) 4,45-4.67 (1H. m)・4,77 かよび5.05 (2H. ABq. Jm1 (Hz)). 5,22 (1H. d. JmdHz). 5,87 (1H. dd. Jmd かよび5 (Hz).

1660 · 1520 cm-1

8.17(2H· s)· 9.55(1H· d· J=8Hz)

# 突旋例 10

5 権化病(2.5 f) の機化メチレン(60 to md) 冷磨液中に、2-エトキレイミノ-2-(5-7 t) ノー1・2・4-アンプブールー3-イル) 動で(レン病性体:2.16 f) を一15°Cで加え、同義反で50分娩性化水。他カフーアミノー5-

1.出. (メジョール): 8500・1770・ 1720・1670・ 1620・1605・

N.M.R. (de-DMSO· 4): 1.25(5日· t· 3年7日x)· 5.50-5.70(2日· m)· 4.85(2日·

1520 cm-1

q. J=7Hz). 5.10(1H. d. J=4Hz). 5.57(2H. s). 5.88
(1H. dd. J=4E-168Hz). 6.60(1H. t. J=4Hz). 7.65
(2H. d. J=6Hz). 8.07(2H. s). 8.17(2H. d. J=6Hz). 9.50(1Hz). 9.50(1Hz). 4.3=8Hz).

## 夹施例 1 1

実施例 1~10と関係の方法により下記の化合 物を製造した。

(1) アー(2-メトキャイモノー2-(5-ァ モノー1・2・4-ナフブツールー8-イル) アセトフモドリー8-(5-メチルー1.8・4-ナジフツールー2-イルナメナル)-8-セ フエム-4-カルボン酸(シン英佐作)、mp 1フ5~180°C(分解)。 1.8.(メジョール):8850・1780・1680・

1625-1580 cm<sup>-1</sup>
N.M.R.(d<sub>6</sub>-DM80-8): 2.72(5H-8):
5.70(2H-8): 4.00(5H-8):

4.25・4.55(2年 ABq・J=14Hs)・
5.16(14・4・J=4Hs)・5.85
(14・24・J=48Hs)・8.15
(24・s)・9.58(14・4・J=8Hs)
(3) 7-(2-メトキレイモノ-2-(5-ナモノ-1・2・4-チナジナゾールー5-イル)
マキトフモア) - 5-(1・5・4-チナジナメールー2-イルチオメナル) - 5-セフエム-4
スポメル(シン県の(シン県の低)、mp.172~177

1.8. (メジョール): 5550・1775・ 1680・1625・ 1580 com<sup>-1</sup>

N.M.R.(d<sub>4</sub>-DMSO- \$): 5.80(2H· s). 4.00
(8H· s). 4.88· 4.67(2H· &Bq.
d=14HR). 5.22(1H· d· J=5HR).
5.90(1H· 2d· J=5.8HR). 8.20
(2H· s). 9.65(1H· s). 9.67
(1H· d· J=BHR)

(8) フー〔2ーメトキシイミノー2-(5-ナ

°C (分解)。

特期 昭55--11600 (38) アセトアミド ) ーるー(1-アリルー1丝-テトラ フミノー1・2・4ーチアジアゾールー5ーイル) V-8-5-4844444 )- 8-47-1-アセトアミアコーカー(1・五・4ーチアジアゾ - N- 2 - 4 N+ + + + N - 5 - + 7 X L - 4 -4 - カルボン即(レン単性体)、mp 170~ \*\*\*\*\*\* (A \* 4 ) . mp 1 A 0 ~ 4 -5 -6 C ( 1720(分解)。 I.B. (xys-w): 5550 · 1780 · I.B. ( # 5 m - r ) : 5 & 8 0 · 8 2 & 0 · 1 5 5 0 cm-1 N.M.B. (da-DMBO: 8) : 5.67(28: 8). . . . . . . . . . 5.95(8H. s) -( 4.25(2H. ABq. J=15Hz). 4.9-5.5(5H. m). N.M.B. (da-DMSO . s) : 0.92(5H. t. Jm6Hs) . 5.6-6.5(2H· m) · 8.10(2H· s) 1.5-2.1(2H. m).5.12(2H. s. 9.55(1H. d. JmRHs) Jm6Ha) . A. 72 (2H . broad a) . (4) 7-[2->++v/4/-2-(5-7 4.55 + 1 (5 4.58(2E. ABq. ミノー1・2・4ーチアジアソールーネースルン J=15Hs) - 5.17(1H+ d+J=5Hs) ナセトアミド ) ームーセフエムームーカルボン曲 5.82(1H. dd. J=5 + 1 (# 8Hs). ( シン異性体 )、mp 190~195℃ (分解 )。 8.12(2H. broad s). 9.55(1H. I.B. ( x 2 = - p ) ; 5 5 5 0 · 1 7 7 5 · d. J=RHz). 9.57(1H. s) 1 6 8 0 + 1 6 5 0 + (a) 7-12-4-2-4-1-2-15-7 1 5 5 0 cm<sup>-1</sup> \* / - 1 . 2 . 4 - + T UT V - P - 5 - 4 P ) セフエムー4ーカルボン酸(シン具性体)、 アセトアミドリースー(ガー 終る級プトキ mp 160~165 ℃ (分解) レカルポニルアモノ ) メチルー 1・る・4ーチア 1.8. (xv=-~): 5550 · 5250 · ジナソールー 2 - イル ) チオメチルー 5 - セフエ ムーム~カルボン部(シン単件体)、mp 1.5.0 1780 - 1680 -~ 1 5 5°C (分解)。 I.B. ( \$ 5 8 - N ) : \$ \$ 5 0 · \$ 2 5 8 · N.M.B. (d.-OMBO. 8) : 5.79(25: broad s): 5.9-4.0(2H. m). 5.95(5H. 1780 - 1670

4) 4.27 SETF 4.50(2H. ABq. J=14Hs). 5.15(1H. d. N.M.B. (da-DMSO. 8) : 1.40(9H. s). J=4Hs) . 5.1-5.5(2H . m) . 5.70(2H. broad s). 5.95 (8H. s). 4.80 ≥ £U 4.55 5.6-6.2(18. m). 5.85(18. dd. J=4 = 1 (FBH=). 8.15(2H. (2H. ABq. J=15Hz). 4.58 s) . 9.57(1H. d. J=8Hs) (2H. d. J=5Hz). 5.17(1H. d. J=4Hz). 5.85(1H. dd. (8) フーにユーメトキシイミノーユー(5ーア ミノー1・2・4ーチアジアダールーるーイル) J=4 +1 ( 88s) . 8.15(28. 8). 9.57(1H. d. J=8Hs) フセトフミド ) ーるーフセナルナオメチルーるー (7) 7-[2-\*+\*v4 & 1 - 2 - (5 - 7 セフエムールーカルボン砂(シン具性体)、 mp \$ /- 1 · 2 · 4 - + T U T Y - N - 5 - 4 N ) 178~182℃(分解)。 I.B. (メジョール): 3350 · 3250 · ナセトアミドリーるー(5ー アリルナオー1・る・ 1780 - 1680 -

```
終期 7755—11600/379
                                フセトアミド) - るー(2ーチアゾリンー2ーイ
               1 6 2 0 cm<sup>-1</sup>
                                ル)チオメデルーるーセフエムーも一カルボン曲
N.M.B. (da-DMSO. #) : 2.88(5H. a).
                                (シン異性体)、mp 1 7 5 ~ 1 8 0 ℃ (分解)。
        8.27 - LU 8.57(2H. ABq.
                                  I.B. (メジェール): 5550・5250・
        J=18Hz) . 5.85(5H. s).
                                                1780 - 1680 -
        5.75 $ 1 U 8.97 (2H. ABq.
        J=15Hz), 5.84(18. d. J=4Hz).
                                                1620 - 1550
        5.72(4H. dd. dm4 # 10'8Hs).
                                 Q) 7-[2-x++v44]-2-(5-7
        a n7(9H. a). 9.47(1H. d.
                                 11-1-2-4-47577-2-8-421
         J-aHa )
                                アセトアモドリーるー(テトラゾロ( 1.5ーb)
(9) 7-[2-shav4x1-2-(5-7
                                ピリポジン・ムーイル ) チオスチルーカーセフス
フェトフミドリーろーピッジニルチオメチルーる
                                 ムームーカルボン糖(シン具性件)、 mp 175
                                ~ 1 R D*C ( + M ) .
ーセフエムー4ーカルポン酸(ヤン具性体)、
                                  1.B. ( x 2 m - p ) : 5 4 0 0 · 5 2 5 0 ·
mp 170~175°C(分解)。
                                                1885 - 1725 -
 I.R. ( # 3 # - # ) : A 5 5 0 + 5 2 5 0 +
                                                1670 - 1640 -
                1780 - 1680 -
                                                1540 om-!
                1620 - 1540
                                 02 7-[2-114241-2-(5-7
                                 1 / - 1 · 2 · 4 - + T > T Y - N - 5 - 1 N )
 00 7- C2-x+ + V/11/-2- (5-7
11-1-2-4-+TUTY-N-8-4N1
                                 アセトアミドリーるーじ1ー(2-(8-前る級
                                フセトアミド ) ーるー( 1 ー ( るーメトキンプロ
プトキンカルポニルフミノ ) エナル ) - 1 日-テ
                                 ピル) - 1日-ナトラゾール-5-イル)ナオメ
チルース・セフエムールーカルボン酸(シン異性
ムームーカルボン酸(アン単性体)、 mp 2 0 D
                                 体)、mp 165~167℃(分解)。
~205°C(分解)。
                                  I.B. ( * * * - * ) : $ $ 5 0 · $ 2 5 0 ·
 I.R. ( < 2 = - *) : A A D D + 1 7 8 D +
                                                1780 · 1688 ·
                1700 · 1680 ·
                                              . 1620 - 1550
                1620 - 1520
 04 7- (2-x+++/4)-2-(5-7
                                  08 7-[2-x+++14]-2-(5-T.
                                 2ノー1・2・4ーナナジアゾールーるーイル)
ミノー1・2・4ーチアジアゾールーるーイル)
アセトアモドリーろー(1ープロピルー1日-フ
                                 フセトアミドリーカー(カーメナルー 1・2・4
                                 - チァジァソールー 5 - イル)チオメチルー 5 -
トップールーちーイル) ナオメチャーるーセフエ
ムームーカがポン酸(シン果性体)、 mp 1 5 5
                                 セフエムールーオルボン酸(シン具性件)、 mp
~ 1 6 Q*C (分類)。
                                 178~182°C(分解)。
 1.R. (メジョール): 8550·5250·
                                  1.B. ( ## =- N ) : 5 5 5 0 · 8 2 5 0 ·
                                                1780 - 1680 -
                1780 - 1480 -
                                                1680 - 1580
 00 7- C2-*+++4427-2-(5-7
                                  09 7-C2-11+V1E1-2-65-7
                                 11-1-2-4-97574-8-5-48)
ミノー 1・2・4ーナアジアゾールーるーイル)
```

```
特朗 研55-11600(38)
アセトアモドリームー(5ーメトキシメナルー)。
                                アセトアミド ) ーるー(4-プロピルー4年-1・
5 · 4 - + T 5 T Y - N - 2 - 4 N ) + # x + N
                                2・4ートリアゾールーるーイル)チオメチルー
- るーセフエムー4ーカルポン酸(シン晶性体)、
mp 1 7 0 ~ 1 7 4 ℃ (分解)。
                                mp 182~184°0(分解)。
 I.B. (x5m-x): $550 . $250 .
                                 1.B. (xy=-w): 5 5 5 0 · 5 2 5 0 ·
               1780 - 1680 -
                                               1780 - 1680 -
               1 4 5 0 . 1 5 5 0
                                               1 6 2 0 - 1 5 5 0
 m 7.- (2-1142/41/-2-15-7
ミノー 1・2・4ーナアジアゾールー 5ーイル)
                                1・2・4ーチアジアゾールーるーイル)アセト
アセトアミドリーるー(5-メチルチオメチルー
                                アミドリーるー(1-メナルナオメナルー1旦-
1・3・4ーナアジアゾールー 2 - イル)ナオメ
                                テトラゾールーちー イル)ナオメナルー るーセフ
ナルーカーセフエムールーカルボン申(シン単位
                                エムー4ーカルボン数(シン属性体)、 mp 175
件)、mp 17 6~175°C(分解)。
                                ~ 4 7 8 °C ( A 68 ) -
 I.B. (xジョール): 5550 · 5250 ·
                                 I.B. ( # 5 = - * ) : 5 5 5 0 · 5 2 5 0 ·
               1780 - 1680 -
                                               1780 - 1680 -
               1650 - 1550
                                               1620 - 1580
                                 Q) 7-[2-* | ++*/ 1.7-2-[5-7
   7-12-11-2-15-7
ミノー1・2・4ーナナジナゾールーミーイル)
                                ミノー1・2・4ーナアジアゾールー5ーイル 2
アセトアミドリーるー(1ーイソプロピルー1耳
                                アセトアミドリーるー(5-(2-ヒドロキシエ
-ナトッソール-5-イルンナオメナル-5-セ
                                ナルリーミ・る・4ーナアジアソールー2ーイル
フエムー4ーカルポン酸(シン異性体)、 mp
                                ] ナオメナルーるーセフエムー4ーカルボン酸(
180~182*(分解)。
                                シン異性体)、mp 1 7 5 ~ 1 8 0 ℃ (分解)。
 I.B. (メジョール): 3 5 5 0・5 2 5 0・
                                 I.B. (xy=-w): 5 5 5 0 · 5 2 5 0 ·
               1780 - 1680 -
                                               1780 - 1680 -
               1680 - 1580
                                               1650 - 1550
 仰 フーじューメトキシイミノーユー(5ーナ
                                 四 アー(2ーメトキシイミノー2-(5-フ
1/-1 -2 -4-++ ジナゾールース-イルト
                                ミノー 1 ・2 ・4 ーナアジアゾールー 5 ーイル )
プセトアミドリーる- (1- (2-ヒドロキシエ
                                フセトアミドリーるー(5ープロピルー1・8・
ナルリー1日-テトラゾールー5-イルリナオメ
                                4 - チェジェゾールー 2 - イル)チオメチルー 5
ナルー5ーセフエムー4ーオルポン酸(シン異性
                                ーセフエムールーカルボン数(シン具性体)、
件)、mp 170~175°C(分解)。
                                mp 1 7 7 ~ 1 8 0 °C (分解)。
 I.B. (x 2 = - x ): 8 3 5 0 · 8 2 5 0 ·
                                 I.B. (x / m - w ): 5 8 5 0 · 8 2 5 0 ·
               1780 · 1680 ·
                                               1780 - 1680 -
```

Q4 7-52-11-2-15-7

ミノー 1 ・2 ・4 ーナアジアゾールーるーイル)

1625 - 1550

7- [2-11-41-2-15-7

ミノー1・2・4ーナアジアゾールーるーイル)

1 - 5 - 4 - テアジアゾール - 2 - イルリナオメ - 5 - セフエム・4 - カルボン酸(シン晶件 体)、mp 1 6 5 ~ 1 7 D\*C (分解)。 I.B. ( # 5 m - w ) : 5 5 5 0 . 5 2 5 0 . 1780 - 1680 -1620 - 1580

節 アーミューメトキシイミノーユーミラーア ミノー1・2・4ーチアジアゾールー3ーイル) 7 t + 7 f F ) - 5 - ( 5 - × # × 3 × # × 7 t ドメナルー 1・8・4ー チナジアソールー2ーイ ( シン単性体 ) 、mp 1 7 0 ~ 1 7 5 ° C (分解 )。 I.B. ( # U m - # ) : A A S O · A 2 S O ·

> 1780 - 1480 -1420 - 1580

O 7-[2-114048]-2-(5-7 ミノー 1・2・4ーナアジアゾールーるーイル)

**韓期 昭55-11600(39)** ナナトマスドリースー (スープリルチオー 1・2・ 4-チャジアソールーちーイル)ナオメナルーる フェムームーカルボン酸(シン晶性体)、 mp 170~178°C(分無)\_

1.B. (x 5 m - pr): A 5 5 0 + 5 2 5 0 + 1780 - 1680 -1620 - 1580

m 7-(2-x+++/41/-2-(5-7 ミノー 1 ・2 ・4 - チァジァゾールーるーイル) **ウセトフセドコーるー(5ーメンルメナルー1・** 14-+フジナソール-2-イルリナオメナル ームーセフエムールーカルボン酸(シン具性体)、 mp 175~180°C(分解)。

I.B. ( # # = # ) : 5 5 5 0 · 5 2 5 0 · 1780 - 1680 -1620 - 1550

₩ 7-C2-314+4127-2-(5-7

18

フェトフミドリーる- ( 1-スルホナトメチルー 18-+194-4-5-441+#\* ーセフエムー4ーカルポン数のナトリウム塩(シ ッ晶体体 )、mp 2 0 5 ~ 2 1 0 °C (分解)。 1.B. (xy=-w): 8550 · 8250 ·

1780.1480. 1580 om-1

(4) フーじューメトキャイミノーユー(5-7 ミノー 1・2・4ーチブジナゾールー 3ーイルコ マセドアミアコーカー (ボーメチルー4月-1・ 2・4ートリアソールー 5 ー イルリナオメナルー スーセプエムールーカルボン袋(シン単物体)、 mp 180~185°C(分解)。

1. B. ( & U = - N ) : 8 5 5 D . 8 2 5 U . 1780 - 1680 -1620 - 1550

as 7-[2-\* | + + + / 4 / -2 - ( 5 - 7

4ノー1・2・4ーチアジアゾールー8ーイル) 

メチルフミノ ) エチル ) - 1 ユーテトフゾールー B-イル ] チオメチルーB-セフエムー4ーカル A# ).

1.E. ( # ジョール ) : 8 5 5 0 · 8 2 5 0 · 1620 - 1580

90 7-C2-31+V/4/-2-(5-7 \* /- 1 . 2 . A - + T U T V - W - 8 - 4 W ) アセトアモドリー8ー(4ー(8ーメトキシブロ ピル ) - 4 ほー 1 ・2 ・4 - トリアゾールー 6 -イル ) チオメチルー 5 - セフエムー 4 - カルギン 章(シン典性件)、mp 175~18°0°0(分解)。 1.B. (#ジョール):5550·5250·

1780 - 1680 -1 6 2 0 . 1 5 8 0

フーじューメトキシイミノーユー(ちーナ ミノーリ・2・4ーナアジアゾールーるーイル) アセトアミド) - 8 - (5 - (2 - アミノエナル) - 1 · 8 · 4 - チアジアゾール - 2 - イル) + オメナル - 5 - セフエム - 4 - カルポン酸 ( レン 風性伴 )、mp 205 - 210°C (分解)。 1.8. (ヌジョール): 5200 · 1770 · 1670 · 1620 · 1580 cm<sup>-1</sup> ms 7 - (2 - メトヤレイミノ - 2 - (5 - ア

図 7-(2-メトキャイミノ-2-(5-アミノ-1・2・4-チャジアゾールー 5-イル)
アキトアミド) - 5 - (5-アミノメテルー1・
5・4-ナアジアゾールー2-イル) ナオナテル
- 5-セアエムー4-カルボン酸(ビン具能体)、
mp 210~215\*C(分解)。

1.B. (\*9=-\*): 8850 8200 . 1770 1680 1620 cm<sup>-1</sup>

韓陽 昭55—11600(40) るーセフエムー4ーカルポン酸(レン具性件)。 mp 200~205°C(分解)。

1.8. (x × a - x ): 8 8 5 0 · 8 2 0 0 · 17 7 5 · 16 7 0 · 16 2 0 · 15 8 0

| 瞬 | パー(2ーエトキシイミノー2ー(5- ア ミノー1・2・4ーチアジアゾールーるーイル) アセトアミア)セファロスポラン酸(シン県佐佐)、

アセトプモド)セフアロスポテン像(シン属性体) mp 1 4 0 ~ 15 6 ° 0 (分解)。 I.B. (スジョール): 5 5 7 0 ・ 5 2 5 0・ 1780・1780・

1680 · 1620 · 1580 · 1880 · 1240 · 1040

N.M.R. (d<sub>6</sub>-EMSO · 8) : 1.25(8H · s · J=7Hz) · 2.00(8H · s) · 5.7

(2H · m) · 4.17(2H · q · J=7Hz) · 4.65 s-2U5.00(2H · ABq ·

J=12Hz). 5.10(1H. d. J=4.5Hz).
5.80(1H. dd. J=4.5 >> LUS.0Hz).
8.1(2H. broad s). 9.56(1H.
d. J=2Hz)

m 7- (2-エトキレイミノ-2-(5-ア ミノ-1・2 汽-ケアジアゲール-5-イル)ア セトアミド)-3-(1-(3-(は一路る数プ トキレカルボニルアミノ)プロピル)-1は-テ >フゾール-5-イル)ナオメチル-3-セフェ ム-4-カルボン酔(レン典性体)、mp 183

1.8. (xy=-\nu): 6570 - 5240 - 1780 - 1690 - 1650 - 1550 - 1680 - 1240 - 1170 - 1040

gn 7-〔2-エトキシイミノ-2-(5-ナミノ-1·2・4-サアジアソール-6-イル)ア セノー1·2・4-サアジアソール-6-イル)ア セトアミドリー6-〔1-〔2-〔8-収5曲ブ トキンカルポニルテもノ)エテル] ~1日-テト テゾール- 5 -イル ] チオメチル- 5 -セフエム - 4 -カルポン樹( Vン異性体)。

1. M. ( \* 2 m - \* ) : 5 8 6 0 · 5 2 4 0 · 17 8 0 · 16 9 0 · 16 5 0 · 15 5 0 · 18 7 5 · 12 5 0 · 117 0 · 10 4 0

図 ブー(2-エトヤレイミノ-2-(5-ア ミノー1・2・4-サアジアザール-5-イル) アセトフミド)-5-(1-メチル-1以-アト アザール-5-イル)テオメナル-3-セフエム -4-カルボン酸(レン異性体)、mp 1 5 6-15970(分解)。

1.8. (x2=-x): 5560 · 5250 · 1780 · 1680 · 1625 · 1580 · 1625 · 1580 · 1080 · 1040

F. W.

職 7 - (2 - エトキャイミノ - 2 - (5 - ア ミノー 1・2・4 - ナアジアツール - 5 - イル ) マトアミド ) - 5 - 〔1 - (2 - (N・N - ジ メナルアミノ)エナル) - 1 ほ - ナトアツール -5 - イル )ナオスナル - 5 - ヤアエム - 4 - カル ポン酸(レン異性体)、mp 1 7 7 - 1 8 8 ° 0 (

om~1

1 5 8 0 . 1 0 4 0

成 7 - (2 - エトヤレイミノー 2 - (5 - ア ミノー 1 ・2・4 - サアジアソール - 5 - イル ) マセトフミド) - 5 - (1 - アリル - 1 出ーナト アゾール - 5 - イル ) ナオメナル - 5 - セフエム - 4 - カルボン酸 ( レン異性体 )、AP 160 ~ 165\*\*\*( 分解 )。

1.8. (xy=-x): 5580 · 5250 · 1780 · 1680 ·

特別 昭55-11600 (41) 1680・1580・ 1880・1048

40 7-(2-エトキャイミノー2-(5-7 ミノー1・2・4-ナアジアゾールー5-イル) フセトフミドリー5-(ナトラゾロ(1・5b)ピリダジンー6-イルリナオメテルー5-セフエム-4-カルボン数(ヤン異性体)、四 ィホロー185\*C(分解)。

1.8. (xyu-r): 5 5 5 0 · 5 2 4 0 · 17 8 0 · 16 8 0 · 16 8 0 · 16 2 0 · 15 5 0 · 18 8 0 · 10 4 0

★20 7-(2-エトキャイミノー2-(5-アミノ-1・2・4-テアジアゾールー5-イル) マセトァミド)-5-(5-アミノノナルー1・3・4-テアジアゾールー2-イル)テキノテルー3-4-テンスム-4-カルボン酸(ゲン製物件)、mp 198-205'0(分解)。

I.B. (メジョール): 3850 · 8250 · 1775 · 1680 ·

1620 • 1555 •

1 5 8 8 • 1 0 4 9

脚 アー ( 2 - エトキシイ E ノー 2 - ( 5 - ア モノー 1 ・ 2 ・ 4 - ナアジアゲール - 5 - イル ) アセトアモド ) - 5 - ( 1 - ( 2 - ヒドロキシエ ナル ) - 1 三 - ナトフソール - 5 - イル ) チオメ ナル - 5 - セフエム - 4 - カルボン酸 ( シン画店 休 )、mp 1 7 0 - 1 7 8 \*\* ( 分解 )。

1.B. (xy = - w): 8850 · 8240 · 1780 · 1675 · 1625 · 1580 · 1880 · 1040 ·

## 7-(2-x++v/4/-2-(5-7 4/-1-2-4-+727Y-w-5-4w) 74:74V)-5-(4-78w-48-1-2-4-1-77Y-w-5-4w)+#\*\*\* 5 - セフエムールーカルボン酸(ジン具性件)、 mp 185~190°C(分解)。

1.8. (xy=-k): 8850 · 8250 · 1780 · 1680 · 1680 · 1625 · 1580

1.B. (x2=-x): 8850 · 8250 · 1780 · 1740 ·

1680 - 1620 -

1580 cm - i

18 7-(2-x++v4x)-2-(5-7 x)-1·2·4-+yyyy-n-5-4n) yx+yxF)-5-(8-xn4+v-1·2· 4-+yyy-n-5-4n)+xx+n-5

```
勢期 前55-- 1 1 6 0 0 (42)
   - + 7 X A - 4 - P + # Y @ ( + Y = # # ) .
                                             トフソールーラーイルコナオメナルー
   mp 175~180°C(分解)。
                                      るーセフエムールーカルポン酸(シン晶性体)、
     I.R. (メジョール): 8850・8250・
                                      mp 195~210°C(分解)。
                                       I.B. ( # 2 = - N ) : 8 5 4 0 · 8 2 1 0 ·
                    1780 - 1780 -
                    1680 - 1620 -
                                                      1770 - 1675 -
                   1550 om-1
                                                      1420 - 1550 -
    40 7-12-x1-24-1-2-15-7
                                                      1880 - 1040
   4 /- 1 · 2 · 4 - + 7 - 7 - 2 - 4 - 5 - 4 w )
   アキトアミドリーるー( 1- ( 8+アェノアロピ
                                       柳 7- (2-イソプロポキシイミノー2-(
   ル)-1旦-アトラゲール-5-イル]チオメチ・
                                      5-79/-1・2・4-ナアジアゾールー 5-
   かーるーセフエムールーカルボン数(シン単体体)、
                                      イル ) アセトアミド ] ー るーセフエムームーカル
   mp 182~185°C(分配)。
                                     ボンタールーニトロペンジル(シン具件体)、mo
    I.B. ( # 5 m - # ) : 5 5 5 0 · 5 2 0 0 ·
                                     145~150°C(分解)。
                   1770 - 1670 -
                                       I.B. ( **= ~ ) : 6800 · 1775 ·
                   1620 - 1580 -
                                                      1720 - 1670 -
                   1 4 8 8 . 1 0 4 0
                                                      1420 - 1400 -
                                                      1 5 2 0 cm-1
    18 7-12-=+++/4/-2-(5-7
                                       N.M.B. (4=DMSO. #) : 1.27(4H. 4. J=7Hs).
   もノー1・2・4ーナアジアソールー五ーイル)
                                              5.55-5.77(2H· m) · 4.17-4.67
                                              (1H. m) . 5.17(1H. d. J-4Hs)
   7 * > 7 # P ] - 5 - ( 1 - ( 2 - 7 # / x + w )
        5.42(2H. s). 5.95(1H. 44.
                                      $8 7-62-4770#4×4 81-2-6
         J=4 ⇒ よび8日±)・ 6.67(1日・ t・
                                     5-781-1-2-4-+7577-1-6-
      J=4Hs). 7.86(2H. 4. J=8Hs).
                                     イル)アセトアミドリーるー(1ーカルボキシュ
         8.15(2H. s). 8.25(2H. 4.
                                     ナバー 1且-アトラソールー5-イルリナオメナ
        JoBEs) . 9.55(18. d. JoBEs)
                                     ルーるーセフエムー4ーカルボン酸(シン異性体)、
 80 7-[2-4y # # # # 4 4 1 - 2 - (
                                     mp 1 7 5 ~ 1 8 0 * C (分解)。
5-7-11-1-2-4-+TUTY-N-5-
                                     · I.B. (xy m - r): 5500 · 5200 ·
イルンプセトアモビンーるー(5-(N-煎る紋
                                                     1770 - 1720 -
プトキシカルポニルフミノンメチルー1・8・4
                                                     1680 - 1620 -
- チャジァゾールー 2 - イル ] ナオメチルー 5 -
キフエムー4ーカをボン酸(シン長物件)、 mg
                                         7-[2-11-4-4]-2-(5-7
140~145*0(分解)。
                                     ミノー 1・2・4ーチアジアソールー 8ーイル)
 I.B. (x5=-x1:8800 · 1780 ·
                                     アセトアミド)ーるー(5ーカルポモシメナルナ
                1670 - 1620 -
                                     オー1・8・4ーナアジアソール-2-イルコナ
                15 & C om-
                                    オメナダーるーセフエルールーカルボン数(シン
 N.M. R. (da -DMSO. 8) : 1.18(6H. d. Jm6Hz).
                                    異性体)、mp 150~155°C(分解)。
         1.52(9H. s). 5.62(2H. broad s).
                                      I.B. ( # 5 = - # ) : 5 $ 5 0 . 5 2 5 0 .
         4.17-4.75(5H. m) 5.17(1H. d.
                                                     1780 - 1720 -
```

. .

J=4Hz). 5.84(1H. dd. J=4 > 10f 8Hz). 8.18(2H. s). 9.65(1H. d.

J-6Ha)

```
45 EM EX755--- 1 1 6 n.n. (42)
                                個 フーにユーイップロポキシイモノーユー (
 63 7-[2-1yra#4v14]-2-(
                               5-アミノー1・2・4-ナアジアゾールー5-
5-731-1-2-4-+7577-4-5-
イル)アセトアミドコーるー(1ーメチルー1丑
                               イルンスセトアモドリーるー(テトラゾロ〔1・5
-ナトラゾールー5ーイル)チオメチルー5ーセ
                               - b ] ビリダジン - 6 - イル ) チオメチル - 8 -
フエムー4ーカルポン数(シン具性体)、mp
                               セフエムー4ーカルポン酸(シン属性件)、 mp
17.0~175°C(分解)。
                               165~170°C(分解)。
 I.B. (xy=-*): 5550 · 5250 ·
                                 1.R. ( # 2 # - # ) : 5 5 0 0 · 5 2 0 0 ·
                                              1775 - 1710 -
               1780 - 1680 -
                                              1670 - 1625 -
               1620 . 1550
               6m-1
                                1989 アーじューイソアロポキシイミノーユー(
 Bb 7-[2-4y70## v41/-2-(
                               5ーナモノー1・2・4ーナアジアゾールー5ー
5 - フミノー 1 ・2 ・4 - チナジナゾールー 5 -
                               イル) アセトアミド) - る - (1- アリル- 1耳
イル)アセトアミド)ーるー〔1-(2-(N-
                               -テトフソール-5-イル)ナオメナル-5-セ
第五級プトキシカルポニルフモノ)エチル) - 1
                               フェムーモーカルポン酸(シン具性体)、 mp
且ーテトラゾールー5ーイル 3 ナオメチルー5 -
セフエムー4ーカルボン酸(シン臭性体)、 mp
                                1 5 5 ~ 1 4 Q * C (分解)。
142~147°C(分解)。
                                 1. K. ( x U = - p): 5 5 5 0 · 5 2 5 0 ·
                                             1780 - 1680 -
 I.B. (メジョール): 5550 · 5250 ·
               1780 - 1690 -
                                             4 4 2 5 . 4 5 5 R em-1
               1 A 5 G · 1 5 5 D cm-1
                                   7- (2-* | * * * * * / * / - 2 - (5 - 7
 物 アーじューメトキシイミノーユー(5ープ
 アセトアミド ) ーるー(5ートリフルオロメチル
                                ミノー1・2・4ーチアジアソールー8ーイル)
 - 1 · 8 · 4 - + T ジナゾール - 2 - イル ) チェ
                                アセトアミドリーるー( 5 - メチルアミノー 1 ・
 メナルーるーセフエムーモーカルポン数(シン長
                                る・4ーチアジアゾールー2ーイル)チャメチル
 性件)、mp 150~155°C(分解)。
                                - るーセフエムームーガルポン酸(シン晶性体)、
  I.R. (xジョール):5500·5200.
                                mp 175~180°C(分解)。
                1770 - 1670 -
                                 I.B. (メジョール): 5450 · 5570 ·
                1620 - 1520
                                               8 2 5 G · 1 7 7 5 ·
                                               1710 - 1480 -
  80 7- (2-x + + v + 1 / - 2 - (5 - 7
                                               1680 - 1560
 ミノー1・2・4ーナアジァゾールーるーイル)
 アセトアミドリーる- (2-カルポキシメチル-
                                 奴 フーじスーメトキャイミノースー(5-ァ
 5-#47-2.5-9270-1.2.4-1
                                ミノー1・2・4ーナナジアゾールー るーイル)
 リャンロ(4・3-b)ピリダジンー6ーイル) (様 アセトフモド)-3-(5-フモノー1・3・4
チオメチルーるーセフエムー4ーカルポン酸(シン
                                - チアジアゾールー2ーイル)チオメチルー 5 -
異性体)、mp 2 0 5 ~ 2 1 0 ° C (分解)。
                                セフエムールーカルボン数(シン具性体)、 mp
 L.B. (x5=-w):8500 · 1765 ·
                                165~170°C(分解)。
              1710 - 1680 -
                                 I.B. (x5=-w): 5550 · 5210 ·
              1620 - 1550 -
                                               1770 - 1670 -
```

1620 · 1520 om-1

1520 cm-1

88 7-[2-11+v/4/-2-(5-7 47-1-2-4-+7577---8-4-1 プセトアミドリーボー [ 1 - (五 - (ガー 無大祭 プトキシカルボニルフミノ ) デロビル ) ニ + 日 ニ ナトラゾールー5ーイル)ナオメチルー3ーセフ エムーモーカルボン酸(レン品性体)、 mp 175~189°C(Am). I.B. (メジョール): 5570 · 5250 · 1785 - 1690 -

1650 - 1550

四 フー〔2~メトキシイミノー2~(5~ァ 8/-1·2·4-+Tジナゲール- 5-4×1 7 t + 7 t F 3 - 6 - ( 1 - ( 5 - ( 7 t + 7 t F ) プロピルリー1旦-テトラダール・5ーイルゴチ オメチルーカーセフエム・4 - カルボン曲(シン 異性体)、mp 158~155°C(分解)。

i.h. (メジョール): 8850・8250・ 1780 - 1660 -1 6 2 0 · 1 5 5 0 cm

83 7- [2-\*++v/4/-2-(5-7 ミノー1・2・4ーナアジアソールーろーイル) ------ドメナル ) エナルー ( 且ーナトラゲールー5 ーイ ルンチオメチルーモーセフエム・4ーカルポン器 ( シン異性体) 、mp 160~165°C (分解)。

I.B. (メジョール): 5 5 5 0 · 6 2 5 0 · 1780 - 1660 -1 4 2 0 + 1 5 5 0

49 MA 4855-- 1 1 6 0 R (44)

7- (2-11424 11-2- (5-7 ミノー 1 ・2 ・4 - チアジアゾールーるーイル) フャトアミドリースーパ 1ー(1-(ガー放え祭 - + + + y - n - 5 - 4 n ) + \* + + n - 8 - \* フェムームーカルボン酸(ジン基体体)、MD 180~185°C(分解)。

I.B. (ヌジョール): 8870・8280・ 1780 - 1690 -1 6 5 0 · 1 5 5 0 cm

何 フーじスーメトキシイミノースー(5-ァ 7 = + 7 = F ) - 8 - ( 1 - ( 8 - ( 8 - N - 9 メチルアミノリプロピルリー 1 丑一テトラソール - 5 - イル)ナオメチルー 5 - セフエムー 4 - カ ルポン酸(レン異性体)、mp 165~170°C (分解)。

I.R. (x3=-~): 8850 · 8200 · 1770 - 1670 -

1610 - 1550 前 フービューメトギシイミノーユー(5ーナ

ミノー1・2・4・チアジアゾールーモーイル) アセトアミドリーるー(1-(2-カルポキシエ ナルリー1月-テトラゾール-5-イル)チオス ナルーろーセフエムーモーカルポン酸(レン晶性 体)、mp 150~155°C(分解)。

I.B. (xジョール):8800·8150· 1770 - 1720 -

1670 - 1620 -

N.M.B. (d.-DMSO. #) : 2.93(2H. 1. J=9Hs). 5.70(2H. broad s). 8.92(8H. s). 4.27 > 154.48 (2H. ABq. J=14Hz). 4.45 (2H. t. #=9Ht). 5.17(1H.

d. J-4Hz). 5.85(1H. dd. J=4 + 1768Hi). 8.18(2H. 1). 9.67(1H. d. J=6Hz) (A) フーじ 2 - メトキ シイミノー 2 - じ5 - フ

1520 cm-

ミノー 1・2・4ーチァジアゾールーるーイル) アセトアミド ) ーるー(1-カルボキシェナルー 1H-T177-N-5-4N1+# s+N-8 ーセフエムールーカルボン酸(シン異性体)、 mp 128~125°C(分解)。

L.B. ( # 2 H - N ) : 5 5 1 1 4 5 7 10 1 1750 - 1720 -1680 - 1620 -1528 cm-

W 7-12-47708+4451-2-1

**韓期 昭55─1160** 0 (45)

5 - アモノー1・2・4 - ナアジアゾールーるー イル1アセトフモド1 - る - (5 - アモノメテル - 1・3・4 - サアジアゾール - 2 - イル1 ナオ メテルー 5 - セフエム - 4 - カルボン像(レン異性 体)、mp 2 1 0~2 15で(分解)。

I.B. (x2=-~): 5 5 5 0 · 5 2 0 0 · 17 5 0 · 16 7 0 · 16 2 0 · 15 5 0

. . . .

関 アー(2-インプロポキシイモノー 2-( 5-アモノー1・2・4-テァジァゾール-5-イル)アモトアモド) - 5-(1-(2-アモノ ルエナル) - 1日-アトラゾール-5-イル)テォ メナル-5-セアエル-4-カルボン酸(シン裏 音体)、3D 195~200(の級)

I.B. (メジョール): 3 3 5 0・8 2 5 0・ 1775・1680・

----

94 7- (2-×+++/1)-2-(5-+

1ノ-1・2・4-チアジアゾールーを-イル) アセトフェドリーを-(1-(5-アミノア=ピ ル)-1以-アトプゾールー5-イル)チメメチ ルーを-セフエム-4-カルポン爾(ヤン異性件)、 mp 185-190°0(分解)。

I.B. (x5=-~): \$ \$ 0 0 · \$ 2 0 0 · 1770 · 1670 · 1610 · 1580

gs 7-(2-メトキヤイモノ-2-(5-ア モノ-1・2・4-ナプブツールー3-イル) アセトアモドリー3-(1-(1-(アモノメナ ル)エテル)-1月-アトワビールー5-イル) オメナルー3-セフエム-4-カルザン数(/ シ馬佐佐)、mp 190-198\*0(6数)。

I.A. (メジョール): 8850・8280・ 1770・1670・ 1620・1580

m~1

の アーじューインプロポキシイミノーユー(

5 - アミノー 1・2・4 - チアジアゾールー 5 -イル ) アミトフミド 3 - 5 - セフエム - 4 - カル ボン酸(シン真性体)、mp 2 0 8 ~ 2 1 5 ° C (

分解)。 - 1.B. (メジョール):る400・8850・

1660 - 1650

1610 · 1520

四 7-〔2-エトキャイモノ-2-〔5-アモノ-1・2・4-ナアジフアール・5-イル) プセトアモド)-5-セフエム-4-カルポン酸 (ビン具性件)、mp 190~195\*0(分解)。 〔.R. (エジョール):8400・8400・

8200 · 1770 · 1670 · 1650 ·

1670 - 1680

### 夹单侧12

5 塩化降(δ.12 f )の治塩化メナレン(δ 7 m4 ) 移液に、2ーメトキシイミノー2ー(5ー

フミノーミ・2・ムーチアジアゾールームーイル) 藤徹(レン集性体:1.811)を−15°0で加 更に0~− A\*C でδ O分尖々機能した。 他カフ - アミノーるー(1・8・4ーチアジアゾールー ボン物 ( 1.82 ) ととりメチルとリルフセトフ ミド(51)の塩化メチレン(25ml)中盤合 他を加畠して機明企際能とし、次いでー1 0°Cに 冷却した。との器骸を、先に得た岳性配合物に加 え、-5~0°Cであ分権券した。 反応混合物を **炉通し、炉液に炭酸水素ナトリウム水溶液(80** 四4 )を加え、塩品で接持した装塩化メチレンを 留去した。水層に10%塩酸を加えて pil 1とし、 ダイヤイオン以下-20機関(略集:三等化成工 養株式会社長:200ml)のカラムクロマトグ フフィに暴騰し、水、20分水性メダノール ( 5 0 0 ml ) 及び4 0 96 本件メダノール ( 5 0 0 四4) で駆攻勝出し、 淋出機を凍結乾燥すると、 7-(2-\*+\*\*\*41-2-(5-\*\*\*)

アモノー1・2・4・サアジアゾールー3・イル) アセトアモド3・3・(1・5・4・サアジアゾ ールー2・イル) サオメナルー3・セフエム・4 ーカルボン酸(アン共転件:4・4 D M )が移ら れた。mp 1 4 D ー 1 4 5\*0 (分解)

1.B. (×5m-v):5180:1765:

N.M.R.(d<sub>g</sub>-DMSO· s): 5,72(2H· broad s).
5,95(5H· s)· 4.52 > LV 4.57
(2H· ABq· J=15Hz)· 5,17
(1H· 4· J=5Hz)· 5,85(1H·
dd· J=5 > LV SHz)· 9,58(1H·
s)· 9,46(1H· 4· J=6Hz)

### 央施例15

フー(2-メトキシイミノー2-(5-フミノ - 1・2・4-ナアジアゾールー8-イル)ナセトアミド)ー8-セフエムー4-カルポン酸(シン具性体)の製造

ル(18mf)、 酢糖(D.25mf)及び水(

2.5 ml ) の単会施中化。 7 - [ 2 - メトキシイ

a / - 2 - ( 5 - 7 a / - 1 · 2 · 4 - + 7 ジ7

1. A. (メジョール): 8550・1775・ 1680・1680・ 1550 cm<sup>-1</sup>

45 FM 12755--- 1 1 6 0 0 - 461

N.M.B.(dg-DMSO: #): 8,60(2日: broad s): 8.98(5日: s): 6.10(1日:

d. J=4Hs). 5.85(1H. 2d. J=4.8Hs). 6.50(1H. t. J=4Hs). 8.10(2H. s). 9.57(1H. d. J=6Hs)

### 夹施例14

2

7 - (2 - エトキャイミノー2 - (5 - アミノ・
1・2・4 - キャプアゾールー3・イル)フィ
・コトコペンジル(シンスト・4 - カルボン酸 - 4
-ニトコペンジル(シンス族性:5.0 f)と10
第パラジッムー供素の7 g 形本性アトフトビョフ
ラン(75 mg) 中級版を、水震響面気中で設施 耐した。機能を影響エテルで始めし、映像水溝ナトリッム水極板中に影響をデルで始めした。映像水溝ナトリッム水極板中に影響をデルで始めした。映像水溝ナトリッム水極板中に影響をデルで始めし、映画下下に10 mg 水繊維した。 沈泉寺を集め、勝事エテルで洗めし、被した被戦機した。 沈泉寺を集め、勝事エテルでた・
レこ大板電像すると、7 - (2 - エトキャジフェー2 - (5 - アミノー1・2・4 - キャンフェー 4 - カルボン暦(レン異性件: 1.8 5 f)が得 られた。mp 190~195°C(分解)。 I.B. (メジョール): 8400・8800・ 8200・1770・ 1670・1680・ 1670・1680・ 1620・mm\*\*

a-DEHO. 8): 1.25(BH. b.

J=7Hx). 5.58(2H. broad s).

4.17(2H. q. J=7Hx). 5.07

(H. d. J=4Hx). 5.88(1H.

dd. J=45x(FBHx). 6.45(H.

t. J=4Hx). 8.05(2H. s).

9.60(H. d. J=4Hx).

# 安施病15

実施例13及び14と同様の方法により下配の 化合物を得た。

 フエムー 4 ー ボルボン数(シン 具性体)、 mp 1 7 0 ~ 1 7 5 ° 0 (分解)。

I.B. (#98-#): 8500 · 1780 ·

(3) 7- 「2 - メトキシイモノー 2 - 「5 - ア モノー 1・2・4 - ナアジアゾールー 8 - イル) アセトフモドリー 5 - 「1 - メナルー 1 以一テト アゾールー 5 - イルナオメテル) - 8 - セフエム - 4 - カルギン歌(レン森性体)、mp 170 -175\*0(分解)。

1.E. (xy=-w):5600 · 1770 ·

1620 mm

(3) アー(2ーメトキャイモノ-2-(5-ア モノー1・2・4-テアジアダール・ファモデモ ドシもファロスポラン歌(アン異数件)、 ap 180~185\*0(分乗り。

1.8. (xym-x): 5550 · 1780 · 1750 · 1680 ·

1 4 2 U . 1 5 E B cm-1

特闘 明55-11608(47)

44 7-(2-メトキャイモノ-2-(5-ア
モノ-1・2・4-ナナジアゾールーもーイル)
アモトブモド) - 8-カルバエイルオヤンメナル
ニカーセフエムー4-カルボン酸(シン美佐作)、
mp 185-190°C(分解)。

1.E. (xy=-w): 8850 · 1780 · 1720 · 1680 · 1720 · 1680 · 1620 · 1550

(b) 7-(2-x+4v4 x1-2-(5-7 x1-1·2·4-+TYTY-N-5-4N) Tx+7xx)-2-x+N-5-47-4-4

- カルボン歌(レン真性体)、mp 175~ 180°C(分解)。

1. m. (メジョール): 5 6 5 0 · 1 7 7 5 · 1 6 7 5 · 1 6 5 0 · 1 7 7 5 · 1 6 7 5 ·

(8)  $\dot{T} - (2 - x + \pi \nu A + 2) - 2 - (5 - 7 + 2) - 1 \cdot 2 \cdot 4 - \dot{\tau} + 7 \cdot 2 + 3 - \nu - \delta - A \cdot \nu$   $\dot{\tau} + b + \tau + p \cdot p \cdot 3 - \delta - (5 - x + \nu - 1 \cdot \delta \cdot 4)$ 

- ナナジナゾール-2-イルチオメチル) - 8-セフエネー4-カルポン数(シン異性体)、 mp 175~180\*0 (分解)。

| 75~180°C (分解)。 | I.B. (エジョール): 5550・1780・

1680 1625

(D) 7- (2 - メトキャイモノ-2- (5 - ア モノ-1・2・4 - テアジアゲールー& - イル) アセトプモドリー& - (1・8・4 - テアジアゲ ールー2- イルギボメテル) - 8 - モフエム-4 - カルボン像 ( ビン員性体 )、mp 172-177 \*C (分解)。

1.8. (x2=-k): 5850 · 1775 · 1680 · 1625 · 1550 · 1680 · 1625

(B) . 7 - て 2 - メトキャイミノ - 2 - (5 - ア ミノ - 1 ・ 2・4 - サアジアダールー 5 - イル) アセトフミドリ - 8 - (1 - アミル - 1 H - デト アゾール・5 - パルドドメナル) - 8 - モフェメ - 4 - カルボン酸ミンン属性体)、mp 1 70 - 172°C(分解)。

1.8. (\*\*\*\*-\*\*): \$850 · 1780 · 1680 · 1625 · 1580 · om-1

(6) アー(2-イソプロポキレイモノー2- C ちーテミノー1・2・4ーチアジアゾールー Sー イル)アセトアミドリー Sーセフエムー 4 - カル ボン酸 (ビン属性体)、mp 2 C 8 - 2 1 5 ° C C 分割)

E.B. (xy=-N): \$400 · \$850 · \$250 · 1770 · 1660 · 1680 ·

1610 - 1520

N.M.E. (dq-DMSO, 8) : 1.27(6H. d.

4.17-4.60(1H· m)· 5.07(1H·

J=4まよび8Hs)・6.45(1H・1・ J=4Hs)・8.07(2H・8)・9.45

			e e
			爾昭5511600(48)
(1H· d· J=8Hz)·			5 2 0 ou-1
00 アーじューイソプロポキシイモノー 5-アミノー1・2・4-ナアジアゾール		(2) フー(2ーメトキシィ ミノー1・2・4ーチアジラ	
4 × 1 7 × 1 7 × F ) - 5 - (5 - (N - )		741747)-8-(5-	
プトキシカルボニルフミノンメナルー 1・.		#-1+5+4-+TVT	
-+TUTY-N-2-4N)+**+N		******	
セフエムー4ーカルボン酸(シン異性体)		美性体)、mp 150~15	
140~145°C(分解)。	••	I.B. (xy=-v):8	
I.B. ( x 5 = - x ) : 8 8 0 0 · 1 7 8	. a ·		780 - 1720 -
1670 • 16	20.		680 - 1620 -
1 5 5 Q om-1		1	5 5 0 cm <sup>-1</sup>
00 フーじューインプロポキシイミノー	2 – (	93 7 - C 2 - イソプロホ	(#¥4 81-2-(
5-781-1-2-4-47575-2	- <b>5</b> -	5-7-1-2-4-4	アジナゾールーるー
イルンアセトアモドリーカー(1ーカルボ	* * *	イルンプセトアモドリーるー	C1-***-1,#
チルー1基ーテトフソール=5-イル)チ:	* * *	- F + 7 Y - N - 5 - 4 N )	+ * * + * - 8 - *
ルーカーセフエムールーカルボン酸(シン)	性体)、	フェムー4ーカドボン数 (.)	ソ異性件)、 mp ·
mp 1 7 5 ~ 1 8 G*C (分解)。		170~175°C(分解)	•
I.B. (メジョール): 5500・52(		I.E. ( x ジョール ) : 5	
× 1770 · 173			780 - 1680 -
1680 - 162		٠, ١	620 · 1580 cm <sup>-1</sup>
4.00			
M 7-(2-177=##+145)-	2 - (		5 2 5 oze-1
5-78/-1:2:4-+TUTY-N		90 7-(2-4y7=#	
4 × ) 7 × + 7 × F ) - 8 - C 1 - { 2 -		(5-71/-1-2-4-	
第5級プトキシカルペニルフミノ)エチル	) - 1	5-4#)7#+74F)-	
且-ナトフソール-5-イル ] ナオメナル		-18-+++y-w-5-	
セフエムールーカルポン酸(シン具性体)	щр	- 8 - セフエム - 4 - カルボ	ン数(シン典性件)、
142~147*0(分解)。		mp 1 8 5 ~ 1 4 Q*C (分解	1.
I.B. ( x 2 m - x ) : 5 5 5 0 · 5 2	5.a ·	I.B. (###-#):5	850-8280-
1780 - 16	70 •		780 - 1680 -
1,680 • 15	5 O	1	625 - 1580
om-1			ct s
03 フーじ 2 ーイソプロ ポキ レイモノー		00 7-12-11-4-11	4/-2-(5-7
5-71/-1·2·4-+Tジナゾール			Y-N-8-1N)
イルリアセトナモドリー8-(テトラゾロ		7 * F 7 A, F 3, - 8 - C 5 -	
5-6)ピリダジャー6-(た)チオメチ		-1 . 8 . 4 - + 7 57 5 -	
ーセフエムー4ーカルボン御(シン具性体	) mp	###-8- 17 EA-4-	
165~170°C(分解)。		性体).mp 150~156*	
I.B. ( ×ジョール ) : 330 B · 32 (		I.B. (#9=-w):8	300 · 3200 ·

特別 第55-11600 (49) 1650 - 1560 05 7- (2-x+++/4)-2-(5-7 ミノー 1・2・4ーナアジアソールーるーデル) W 7-[2-x+++/4]-2-(5-7 アセトアミドリーカー(2ーカルポキシメテルー ミノー1・2・4ーチアジアソールーるーイル) 5- \*\*y-2 · 5 - ジヒドロ-1 · 2 · 4 - ト ナセトアモドリーる- (5-アモノー1・3・4-リアソロ(4・5-b)ピリダジン-6-イル) ナナジァゾールー2ーイル)ナオメナルー5-セ チェメナルーろーセフエムーもーカルボン酸(ジ フェムールーカルボン僧(シン具性件)、 10月 ン具性体)、mp 2 0 5 ~ 2 1 0 ° 0 (分解)。 I.B. (xy=-w) : 8800 · 1765 · 1 6 5 ~ 1 7 G\*C (分解)。 1.8. (メジョール): 8850・5210・ 1710 - 1480 -1770 - 1670 -1620 - 1550 -1620 - 1520 1 5 2 0 cm-1 09 7-[2-1142461-2-(5-7 m 7-(2-114-42)-2-(5-7 41-1-2-4-+7575-2-4-4-1 ミノー1・2・4ーテアジアソールー5ーイル) アセトアモドリーるー(5ーメテルアモノー1・ プセトプミドリーる-C1-(8-(N - 第る級ブ 五・4-ナッジアソール-2-イル)ナオメチル トキシカルポニルアミノ)プロピル)-1旦-テ ーるーセフエムールーカルボン動(シン美性体)、 177-1-5-41)+\*\*+1-5-472 mp 175~180°C(分解)。 ムー4ーカルボン酸(シン具性件)、mp 1 7 5 1.B. (xy=-w): 5450 · 5570 · ~ 1 8 D°C (分解)。 8250 · 1775 · I.B. (メジョール): 5 5 7 0 · 5 2 5 0 · 1710 - 1680 -I.B. (#ジョール): 8850 · 8250 · 1785 - 1690 -1780 - 1660 -1620 - 1580 to 7-(2-114-41-2-(5-7 4/-1・2・4-ナナジアゲールー8-イル) 96 7-C2-x++v441-2-(5-7 ミノー 1・2・4ーナアジアゲールー 5ーイル) 7 t + 7 t F) - 5 - C1 - (5 - (7 t + 7 t アセトアモドリーるーに1ー(ガー館を設プトキ ドンプロピルリー 1日-テトラゾールー 5ーイル シカルポニルアミノメナル)エテル)-1旦-テ ] ナナメナルー 5 ーセフエムー 4 ーカルポン数(ン トラゾールーちーイル)ナオメナルーるーセフエ ン具性体)、mp 150~155°C(分解)。 ムー4ーカルボン数(ジン具性件)、mp 1 8 0 I.R. ( # U = - P ) : 5 5 5 0 . 5 2 5 0 . 1780 - 1660 -~ 185°C(分解)。 1.B. ( # F = - \* ) : \$ \$ 7 0 · \$ 2 \$ 0 · 1620 - 1580 1780 - 1690 -1650 - 1580 19 7-C2-x1+v44/-2-(5-7 ミノー 1・2・4ーナナジアゾールーさーイル) 四 アー(ユーメトキシイミノーユー(5ーア 74174F3-8-61-(1-(74174 ミノー1・2・4 - チャジアソールー 5 - イル) r + + w ) = + w ) - 1 H - + + 7 Y - w - 5 -フセトアミド ) - 8 - ( 1 - (3 - ( N · N - ジメ イル ) チオメチルー るーセフエムー 4 ーカルボン **耐(レン具性体)、mp 160~165°C ( 分** チルフミノ) プロピル) - 1日-テトラゾールー

鮮)。

5-イル)ナオメチルー5-セフエムー4ーカル

34

ポン数(シン異性体)、mp 165~179°C (分解)。

1.8. (メジョール): 585g・52gg・ 177g・167g・ 1610・158g

の 7-[2-メトカレイモノ-2-(6-ア モノ-1・2・4-ナアジアゾールー 5-イル) マキトフモドリー 5-[1-(2-カルボキレエ ナル)-18-ナトアゾールー 5-イル)チオメ ナルー 5-セフエム・4-カルボン酸(レン典性 休)、mp 150~155°(分解)。

1.8. (x2=-x): 8800 · 8150 · 1770 · 1720 · 1670 · 1620 · 1820 om-1 (x764)

**特期**図55− 11600 (50)

畑 7- (3-ノトキシイミノー3-(3-アミノ-1.24 + チアジアゾールー3-イル) アセトアミド ) - 3 - (1-カペポキシノチルー13-ナトラソールー3-イル) チオノチルー3-セフュムー4-カルボン酸(シン異性体), ap
123~125 で 125 で (分解)。

I.R.(ヌジェール): 3300, 3200, 1750, 1720, 1680, 1620, 1520 cm <sup>-1</sup>

関 7-(3-4ソプロポキレイミノー2-( 5-アミノー1,2,4-チアヴァソールー3-イル )アセトアミド)-8-(5-アミノノチルー1 3,4-ナアヴァソール-3-イル)テオノチルー 3-セフェム-4-カルポン酸(シン異性体)、 ap 210~215 セ(分析)。

I.R. (x5,-w):3350, 3200, 1750, 1670, 1620, 1530 cm<sup>-1</sup>

例 7-[2-インプロポキシイミノ-2-( 5-アミノ-1,2,4-チアジアゾールー3-イル )アセトアミド ]-3-[1-(2-アミノエチ

\*

ル) -1 エーチトクソールー 5 - イル) チオメチル ー 3 - セフェムー 4 - カルボン酸 (シン異性体) 、 mp 195 ~ 800 ゼ (分解)。

mp 185 - 190 で (分解)。
I.R. (エジェール): 3300, 3200, 1770,
1670, 1810, 1830 cm - 1

0日 で (2 - / トキシイミノー3 - (5 - アミノー1.2 4 - ナアロアゾールー3 - イル) アセトアミド ) - 3 - (1 - (1 - (で ミノメチル) ナナトノー ) - 1 モーテトタソールー5 - イル) チオノチルー3 - セフェムー 4 - カルボン酸 (シン異性体)、 = p 190 ~ 105 セ(分展)。

I.B.(x>=-1):3350, 3230, 1770,

1670、1620、1530m<sup>-1</sup> 回 7~[2ーメトキシイミノーュー(5 ー ホ エルンブミノー 1.5.4 ー デンジンソールー 2ーイル ) ブセトブミド ) 一(1.5.4 ー デンジンソール ー 2 ー イル ) デオメチルー 3 ー セフュムー 4 ー カ ルボン酸 (シン 具性体)、mp 140 ~ 145 セ (分析)、

I.R.(スジョール): 3180, 1765, 1670,

脚 T-[2-エトキシイミノ-2-(5-ア ミノ-1.34-サアピアソール-3-イル) アセ トアミド) -3-(1.34-サアピアソール-2 ーイル) チオメチル-3-セフュム-4-カルポ ン酸(シン異性体)、mp 150-185で(分 根)。

1.R.(スジェール): 8350, 3230, 1775, 1680, 1620, 1530cm<sup>-1</sup> 04 7-(2-4ソプロポキシイミノー3-( 5-アミノ-1,2,4-チアジアソール-3-4ル

) アセトアミド ) -3-(1.3.4-チアジアソー

ルー2-イル)テオメチルー3-セフェムー4-カルポン酸(シン異性体)、mp 145~150 で(分解)。

(a)

I.R.(スジョール): 3370, 3230, 1780, 1680, 1625, 1530 cm -1

図 7-{2-イソプロポキシイミノー2-( 5-アミノー1,24-チアジアゾールー3-イル )アセトアミド )セファロスポタン酸 (シン具性 体)、np 150~155で(分解)。

> I.R.(スジョール): 3300, 1780, 1725, 1650, 1520 cm <sup>-1</sup>

向 アー[3-プロポキシイミノー2-(5-アミノー1,24-チアジアソールー3-イル)ア セトフミド]-3-(1,3,4-チアジアソールー 2-イル)チオメチルー3-セフェムー4-カル 水ン酸(シン異性体)、mp 130~133℃ (分級)。

I.R.(エジェール): 3380, 3230, 1780, 1680, 1625, 1530cm<sup>-1</sup> 8D 7 - [2-ノトキシイミノー2-(5-ア ・ 納爾昭55-11609 (5) た ミノー1,3,4 → ナアジアゾールー3 → イル) ア・ トアミド ] ー 3 ー (5 ー (1 一 第 3 数 ブトキシカ ルポニルアミノ) メチルー 1,3,4 ーチアジアゾー ルー 2 ー イル ) チオメチルー 3 ー セフェムー 4 ー カルポン酸 (シン異性体)、mp 150~185℃ (分解)。

1.R.(メジョール): 3350, 3250, 1780, 1670 cm<sup>-1</sup>

(図) サー(2-メトキシイミノー2ー(5-ア ミノー1,24ーチアジアゾールー3ーイル)アセ トフミド)ー3ー(8-アリルチオー1,3,4ーチ アジアゾールー2ーイル)ナオメチルー3ーセア ェムー4ーカルボン酸(シン異性体)、mp180 ~168で(分解)。

> I.R.(スジェール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1620 cm <sup>-1</sup>

図 7-{2-メトキシイミノー2-(5-ア ミノー1,2,4ーチアジアソール-3-イル)ナセ トアミド ]-3-アセチルチオメチル-3-セフ ムム-4-カルボン酸(シン異性体)、mp178

~ 182 ℃ (分解)。

I.R.(スジョール): 3350, 3250, 1780. 1680, 1620 cm<sup>-1</sup>

何 7-(3-メトキレイミノー2-(5-ア ミノー134-チアジアソールー3-イル)アセ トアミド)-3-ビラジエルチオメテルー3-セ フェムー4-カルボン酸(レン具性体)、エp 170~174で(分解)。

1.R.(メジョール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530 cm<sup>-1</sup>

#8 7-[2-パトキレイミノー2-(5-ア ミノー1,24ーチアジアゾールー3-イル)アセ トアミド)ー3<sup>-(2</sup>-(2-チアゾリンー2-イル) オオメチルー3-セフュムー4-カルボン酸(シ レ興性休)、mp 175~180℃(分解)。

I.R.(メジョール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530 cm <sup>-1</sup>

 ダジン-6-4ル)チオメチル-3-セフェム-4-カルボン酸(シン異性体)、np 175~ 180 で(分解)。

I.R.(メジョール): 3400, 3250, 1885, 1725, 1670, 1640, 1540cm<sup>-1</sup>

は 7-{2-メトキシイミノー2-(8-ア ミノー1,24-チアジアゾール-3-イル)アセ トアミド]-3-[1-{2-(第-第3駅プト キシカルボニルアミノネエチル]-1 エーチトラ ソール・8-イル]デオメチル-3-セフェム-4-カルボン酸(シン異性体)、mp 200~ 205で(分解)。

I.R. $(xy_n-\nu)$ : 3300, 1780, 1700. 1680, 1620, 1520  $\omega^{-1}$ 80  $T-(2-\lambda)+\nu\lambda$ :  $\lambda - \lambda = (8-T)$   $\lambda - 1, 2, 4-\nu$ :  $\lambda - 1, 3-\lambda$ :  $\lambda = (8-T)$  $\lambda - 1, 2, 4-\nu$ :  $\lambda - 1, 3-\lambda$ 

4ーカルボン酸(シン具性体)、mp 155~

160℃(分解)。

I.R.(スジャール):3350, 3250, 1780,

1680, 1630, 1530cm -1 似 アー・スーメトキシイミノーユー(カーナ

ミノー1.24ーチアジアソールーネーイル)アセ トアミド ] - 3 - [ 1 - ( 3 - / ) キシブロビル )ー1 ローテトラゾールーミーイル 1チオメチル - 3 - セフェムー 4 - カルポン酸(シン果件体)。 mp 165~167 ℃(分配)。

I.R.(スジョール): 3350, 3250, 1780, 1880, 1629, 1530 cm -1

姆 アー【ユーメトキシイミノーユー(5ーア ミノー 1.2.4ーテアジアソールー3ーイル)アセ トアミド ] ー 3 ー ( 3 ー メチルー 1.2 4 ーチアジ アゾールー 6 ーイル ) チオメチルー3 ーセフェム - 4 - カルボン酸 (シン異性体 )、mp 178~ 182℃(分解)。

I.R. (RD=-N): 3350, 3250, 1780, 1689. 1630. 1530 cm -1

何 7~(2~メトキシイミノー2~(5~7

66 BB 1355- 11600 (52)

ミノー1.24ーチアジアゾールー3ーイル)アセ トアミドリーコー(5ーメトキシメチルー 1.3.4 ーチアジアソールー 2 ーイル)チオメチルー 3 ー セフェムーもーカルポン酸(シン単体体)。 \*\*\* 170~174℃(分解)。

I.R.(スジョール): 3350.3250. 1780. 1680. 1630. 1530 or -1

HP 7-[8-11-42131-2-(5-7 ミノー1.24ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(5ーメナルチオメナルー 1.2 4ーチアジアソールー2ーイル)チオメチルー3 ーセフェムー4ーカルボン酸(シン異性体)、mp 173~175℃(分解)。

I.R. (80 -- A): 3350. 3250. 1780. 1680, 1630, 1530 cm -1 何 7-[2-ノトキシイミノー2-(5-ブ

ミノー 1, 2, 4 ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミド ] - 3 - ( 4 - プロピル - 4 8 - 1.2 4 ートリアソールー3ーイル)チオノチルー3ーセ フェムーも一カルポン酸(シン異性体)、コロ

.

182~184七(分報)。

I.R.(XV=~N):3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530 m-1

纠 7-(2-メトキシイミノー2-(5-ァ ミノー1.24ーナアジアゾールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(1ーメチルチオメチルー18 ーテトラゾールーちーイル)チオメチルー3ーセ フェムーもーカルポン酸(シン具性体)、エロ 175~178で(分解)。

1.R.(RD=-A):3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530 cm -1

前 7-[2-メトキシイミノー2-(5-ア ミノールス4ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(1ーイソプロビルー18ーチ トラソールー8ーイル)チオメチルー3ーセフェ ムー4ーカルポン酸(シン異性体)、mp 180 ~182℃(分解)。

I.R. (XV=-N): 3350, 3250, 1780 1680. 1630. 1530 cm -1

脚 7-[2-メトキシイミノー2-(5-ア

ミノー 1.2.4ーチアジアゾールー3ーイル ) アセ トアミド]ー3ー[1-(3-ヒドロキシエチル )ー18-テトラゾールー5-イル しチオメチル ー 3 ーセフェムー 4 ーカルボン酸(シン単件体)。 mp 170~175 ℃(分解)。

I.R.(スジェール):3350, 3250, 1780, 1680, 1625, 1530 cm -1

何 アーしてーメトキシイミノーユー(5ープ ミノー 1.24ーチナジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー [ 5 - ( 2 - ヒドロキシエチル )-1,3,4ーチアジアソールー2ーイル ]チオメ チルー3ーセフェムー4ーカルボン酸(シン異性 休)、mp 175~180℃(分解)。

I.R. (RDs-N): 3350, 3250, 1780, 1680, 1630, 1530 cm -1

80 7-[2-11+212]-2-(5-7 ミノー1.2.4ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(5ープロビルー1,3,4ーチア ジアソールー2ーイル)チオノチルー3ーセフェ ムー 4 ーカルポン酸 (.シン異性体 )、 mp 177

1680, 1630, 1530 cm -1

MREMESS ... 11600 (63) ミノー1.2.4ーチアジアソールー3ーイル)アセ

トアミド)-3-6-5-(3-アリルチオー1.2 4ーチアジアゾールーちーイル)チオメチルー3 ーセフェムーもーカルボン酸(シン異性体)、ED 170~173℃(分級)。

I.R.(スジェール): 2350. 3250. 1780.

58 7-12-11-21-2-(5-T ミノー 1,24ーチアジアゾールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(8ーメシルメチルー1.8.4ー ナナジナゾールー 2 ーイル ) チオメチルースーセ アェムーもーカルボン酸(シン臭性体)、ap

I.E. ( \$5' -- N): 3350. 3250. 1780. 1680. 1620. 1530 as -1

175~180℃(分解)。

畑 ブー「2ーメトキシイミノー2~(5-ア ミノー 1.24ーナアジアゾールー3ーイル)アセ トナミドリーミー(エースルホナトメチルーIB ーチトラゾールー5ーイル)チオメチルー3ーセ フェムー4ーカルボン酸のナトリウム塩(シン具

1680, 1620, 1530cm -1

ーセフェムー4ーカルポン酸(シン異性体)、== I.R. (エジェール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1630cm -1

I.R. (80 -- W) 13350, 3250, 1780.

NS 7-12-11-21-2-18-7

ミノー1.2.4ーナアジアゾールー8ーイル)アセ

トアミドリー8ー(5ーヒドロキシメナルー1.3.

4-4アジアゾールー2ーイル)ナオメチルー3

~180℃(分解)。

185~170℃(分解)。

66 7-[2-11+++12]-2-(5-T ミノー1,2,4ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミド ) - 3 - ( 5 - メタンスルホンプミドメ チルー1.84ーチアジアソールー2ーイル)チオ メチルー3ーセフェムームーカルポン酸(シン具 性体)、mp 170~175℃(分解)。

I.R.(x2,-w):3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530 cm -1

切 1-[2-メトキシイミノー2-(5-ア

性体)、mp 205~210℃(分解)。 I.R. (x2=-~) 13350, 3250, 1780, 1680. 1530 cm -1

BD 7-[2-11+512]-2-(5-7 ミノー1.24ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリーコー(リーメチルーリヨー124ー トリアゾールー3ーイル ) チオメチルー3ーセフ - ムー4ーカルボン酸 (シン具件体)、 ap180 ~185℃(分解)。

I.R.(スショール):3850, 3250, 1780, 1880, 1620, 1530cm -1

89 7ー[2ーメトキシイミノー3ー(5ープ ミノー1.2.4ーチアジアゾールー3ーイル)アセ トアミド ] - 8 - [ 1 - { 2 - ( H,H - ジノナル アミノ ) エチル ) ー 1 Hーテトラソールー5ーイ ル】ナオメナルー3ーセフェムー4ーカルポン酸 (シン具性体)。 mp 185~190℃(分解)。 I.R. (XV=-4):3350, 3250, 1780,

1680, 1620, 1530 cm -1

100 7-12-メトキシイミノー3-(5-ア

ミノー 1,2.4 ーチアジアゾールー 3 ーイル ) アセ トアミドリー3ー[4ー(3ーメトキシブロビル ) - 4 = - 1, 2, 4 - トリアソール - 3 - イル ] チ オメチルー3ーセフュムー4ーカルポン酸(シン 具性体)、mp 175~180℃(分解)。 I.R.(スジョール): 3350, 3250, 1780,

1680, 1620, 1530 cm -1 料 7-(8-メトキシイミノー3-(8-ア ミノー1.24ーチアジアゾールースーイル)アセ トアミド ) - 3 - (5 - (2 - アミノエチル) -1.3.4ーチアジアゾールー8ーイル ] チオメチル ー 8 ーセフェムー 4 ~ カルポン酸 (シン具件体 )。

I.R.(xジョール):3200, 1770, 1670, 1620. 1530 cm -1

mp 205~210℃(分解)。

BO 7-{2-11-42-12-(5-7 ミノー 1.24ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(5ーアミノメチルー 1.3.4ー チアジアゾールー2ーイル)チオメチルー3ーセ フェムーもーカルポン酸(シン異性体)。ロア

210~215℃(分解)。

I.R.(スジェール): 3350, 3200, 1770, 1680, 1620 cm <sup>-1</sup>

脚 アー【8ーメトキレイミノー2ー(8ーア ミノー1,24ーチアジアゾールー3ーイル)アセ トアミド】-3ー【1ー(2ーアミノエチル)ー 1 Bーテトラゾールー5ーイル)チオメチルー3 -セフェムー4ーカルボン酸(レン異性体),mp 200~205 セ(分解)。

I.R.(スジョール): 3350, 3200, 1775, 1670, 1620, 1530cm<sup>-1</sup>

脚 7-(3-エトキシイミノ-2-(8-ア ミノー1,2.4ーチアジアソール-3-イル)アセ トアミド]セファロスポラン酸(シン異性体)、 mp 140~156℃(分類)。

I.R.(スジャール): 3370, 8250, 1780,

1730, 1680, 1620, 1530, 1380, 1240, 1040 cm <sup>-1</sup>

助 ?ー【2ーエトキシイミノー2~(5ーア

特別部55-11600 (54)

ミノー1,34ーナアジアソールー3ーイル)アセトアミド)-3-[1-(3-(3-第3数プトキンカルボニルアミノ)プロピル)-1豆一テトラゾールー3-4アルトンチオメナルー3-セフェムー4-カルボン酸(シン異性体)、mp 183~185 で(分解)。

I.R.(スジョール):3370, 3240, 1780,

1690, 1630, 1530,

1380, 1260, 1170,

1040 cm <sup>-1</sup>

脚 7-[3-エトキレイミノー2-(5-ア ミノ-1,24-ナアジアゾールー3-イル)アセ トアミド]-3-[1-{2-(耳-第3畝アト キシカルボニルアミノ)エチル}-1ヨーチトラ ソールー5-イル]チオメチルー3-セフェムー 4-カルボン酸(シン異性体)。

I.R.(メジャール):3360, 3240, 1780, 1690, 1630, 1530.

1375, 1250, 1170,

1040 cm -1

関 7-[3-エトキシイミノー2-(5-ア ミノー1,24-ナアジアゾールー3ーイル) アモ トアミド ] -3-(1-メナルー1 E-テトラソ ールー5ーイル) テオメチルー3-セフュムー4 ーカルメン酸(レン異性体)、mp 156~159 セ(分解)。

1.R. (ダジョール): 3380, 3250, 1780, 1680, 1626, 1380, 1080, 1040cm<sup>-1</sup>

○ 7 - [2-エトキシイミノー2-(5-ア
ミノー1,24-チアジアソールー3-イル)アセトアミド]ー3-[1-(2-(5-ア
ミノ)エチル)-1 エーテトラゾールー5-イル)チボメチルー3-セフェムー4-カルボン酸(レン興性体)、コP 177~180 ℃(分解)エル、スジャール):380,380,380,1775。

1670, 1620, 1535, 1880, 1040 cm<sup>-1</sup>

00 7-{2-エトキシイミノー2~(5-ア ミノー124-チアジナソール-3-4ル)アセ トアミド)ー3ー(1ーアリルー1日ーテトラソ ールー5ーイル)チオメチルー3ーセフェムー4 ーカルポン酸(シン英性体)、mp 160~165 で(分解)。

I.B.(xy=-n):3380, 3250, 1780,

1680, 1630, 1530, 1380, 1040cm<sup>-1</sup>

73 7-[2-エトキシイミノー2-(5-ア ミノー1,2-4-チアジアソール-3-イル)アセ トアミド]-3-(アトラソロ[1,5-b]ピリ ダジン-6-イル)チオメチル-3-セフェム-4-カルボン酸(シン具性体)、mp180~186 セ(分無)。

I.R.(スジョール): 3350, 3240, 1780, 1680, 1620, 1530,

1380, 1040 cm -1

加 7-[2-エトキシイミノー2-(5-ア ミノー124-チアジアソールー3-イル)アセ トアミド]-3-(5-アミノメチル-1,24-

チアジアソールー 2 ーイル ) チオメチルー 3 ーセ

188

フェムー 4 ーカルポン酸(シン異性体)、 mp 198~205で(分解)。

1.B.(スジョール): 3350, 3250, 1775. 1680, 1620, 1535, 1380. 1040cm <sup>-1</sup>

64 ?ー(3-エトキシイミノー2-(5-ブミノー1.3.4 →ナブジブゾールー3-イル) アセトブミド )ー3ー[1-(2-ヒドロキシェチル)ー1ヨーテトラゾールー5-イル] ナオメチルー3-セフュムー4-カルボン酸(シン異性体)。pp 170~173℃(分解)。

I.R.(メジョール): 3350, 3240, 1780, 1678, 1625, 1530.

1380, 1040, 720 cm -1

 7 − [2−メトキシイミノ−2−(5−ア ミノ−1,24−ナアジアソールー3−イル) アセ トプミド ) −3 − (4 − アリル−4 Ⅱ −1,24 − トリアソールー3−4ル) ナオメナルー3−セフ ム−4−カルボン酸(シン異性体)、mp 18 2 ~180 で(分解)。 特別招55— 11800 (55) I.R.(ヌジェール): 3350, 3260, 1780,

1880, 1628, 1530 cm<sup>-1</sup>
pd 7- (2-メトキレイミノー2-(5-ブ
ミノー1,24-チアジアゾールー3-イル)アセ
トブミド)-3-(3-メトキシカルボニルー1, 24-ナアジアゾールー5-イル)チオメチルー 3-セブェムー4-カルボン酸(シン具性件), pp 180~185℃(分解)。

I.R.(ヌジョール): 3350, 3250, 1780, 1740, 1680, 1620, 1530 cm <sup>-1</sup>

I.R. (スショール): \$350, 3250, 1780, 1730, 1680, 1620, 1630 cm <sup>-1</sup>



所 7-[8-エトキレイミノー2-(5-ア ミノー1.24-チアピアソールー3-(ル)アセ トアミド)-3-[1-(3-アミノブロビル)-1B-テトラソールー5-(ル)チオメチルー3 -セフェム-4-カルボン酸(レン興性体)、np 182~185で(分解)。

I.R.(エジェール): 3350, 3300, 1770, 1670, 1620, 1530, 1380, 1040 cm <sup>-1</sup>

間 7-[2-エトキシイミノー2-(5-ア ミノー1,24-チアジアソールー3-イル)アホ トアミド ]-3-[1-(2-アミノエナル)-1 ヨーテトラソールー5-イル] ナオメテルー3 -セフェムー4-カルボン酸(シン典性体)、mp 195~21.0 で(分解)。

I.R.(エジェール): 3340, 3210, 1770. 1675, 1620, 1530, 1380, 1040 cm<sup>-1</sup>

実施例16 7-【2ーメトキシイミノー2-(5ーアミノ

- 1.2.4 - チアジアソール- 3 - イル ) アセトア ミド)セファロスポラン酸(シン具性休:3.5g )、ピラジンチオール(1.1.5 )及び炭酸水素ナ トリウム(1.39) first 6.86の舞敗級衡被( .150 #1)中に加えて吹る混合物を70℃で2時 開掛券した。これを氷鉛中で冷却し、10多複数 。で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。抽出液 を破骸マグネシクムで乾燥し、放圧下に 1.6 ピま で政能した。析出物を伊政し、酢酸エチルで洗浄 した後乾燥すると、粗製の?一〔2ーメトキシイ ミノー2-{5-アミノー1,2,4-チアジアソー ルー8ーイル)アセトアミドリー8ーピクジニル チオメチルー3ーセフェムーカルポン酸(シン具 姓体:1.89)が得られた。本品をアセトンに答 解し、活性炭粉末で処理した後溶媒を留去した。 森坊を樹齢水素ナトリウムの水洗液に溶解し、10 ★塩酸を加えて再沈殿させると、結晶( L19 ) が得られた。 mp 170~174℃(分解)。 I.R.(スジョール):3350, 3250, 1780,

1680, 1620, 1530 cm -1

33

H.M.R.(d, -DMSO, #): 3.52 > LU3.70

(2H, ABq, J=18Hs), 3.97 (3H, s), 4.05 > LU 4.57 (3H, ABq, J=13Hs), 5.13 (1H, d, J=4Hs), 5.80 (1H, dd, J=4 > LU 5Hs), 8.12 (2H, s), 8.3-8.6 (3H, m), 9.55 (1H, dd, J=5Hs)

### 实施例17

### 实施例18

7-12-11キシイミノー2-(5-アミノ -1.24-チアジアゾールー3-イル)アセトア ミド ] セファロスポラン酸(シン異性体:3.5g )、1-「2-(3-43級プトキシカルポニル アミノ)エチル]ー1日ーテトラソールー5ーチ オール(2,459)及び炭酸水素ナトリウム(1.8 タ) を p 16.86の気酸緩衝液(150 ml)に加 えて成る混合物を70℃で3時間批拌した。とれ を水溶中で冷却し、酢酸エチルで洗浄した後、10 が複数で pH 2とし、酢酸エチルで抽出した。抽 出被を硫酸マグネシタムで乾燥し、放圧下に10 **咸光最新した。新出物を护取して酢酸エチルとジ** エチルエーテルで洗浄及び乾燥すると、7-[2 ーノトキシイミノー2ー(5ーアミノー124ー チアジアソールー3ーイル)アセトアミドリー3 - 11- 12- (ヨー館3級プトキシカルポニル アミノ)エチル}-18-チトラソールー5-4 ル ] チオメチルー 3 ーセフュムー 4 ーカルポン酸 (シン具性体: 2.0 F)が得られた。 mp 200

特別研究5-11800 (56) 6 ー アミノー1、2、4 ー ナアジアゾールー3 ー イル ) アセトアミド ] ー3 ー (アトラゾロ [ 1.5 ー b ) ビリダジンー6 ー イル) ナオノチルー3 ー セフ エムー4 ー カルボン酸(シン異性体: 2.5 月) が 得られた。本品を水性アセトンド業廃し、 56 世 数 素アトリウム水防液に溶解し、 10 % 程度を設定力 で再比較させると、純品の目的物質(1.15 月) が得られた。 mp 175 ~ 180 ℃ (分解)。

I.R.(メジェール): 3400, €250, 1885, 1725, 1670, 1640.

### 1540 cm -1

H.N.R.(04-DMSO. 8): 3.82 \$\(\text{LU}\) 3.82 (2H, ABq, J-18HE), 3.92 (3H, ABq, J-18HE), 3.92 (3H, ABq, J-14HE), 5.10 (1H, d., J-4HE), 5.80 (1H, d.d, J-4 \$\(\text{LU}\) 8HE), 7.72 (1H, d., J-8HE), 8.10 (2H, e.), 8.56 (1H, d., J-8HE), 9.86 (1H, d., J-8HE)

# 變

### ~ 205 七(分解)。

I.R.(SP=-W):2300, 1780, 1790, 1790, 1800, 1820,

# 实施例19

?ー[2ーメトキシイミノー3ー(5ーアミノー1、2,4ーチアジアゾールー3ーイル)アセトアミド) セテァロスポラン酸(シン典性体:3,5g)、(5ーメルカブトー1ヨーテトラリールー1ーイル)メタンスルホン酸のナトリウム塩(2,18g)及び炭酸水素ナトリウム(1,3g)を pI 6.86の興度要素 (150㎡) に加えて改る局もも、?0でて3時間放井した。これを水筋中下冷却し105塩酸で一

新版 昭55ー 1160c(\$7)

チルで輸出した。水層を、卵イボン性原幹物類( ダイヤイオンエア20)(南駅:三葉化収工度炉 水の土紙列)のカラムクロットグラフェド医療した。 カラムを水洗し、305×柱メタノールで搭出した。 路出波からメタノールを留去し、液越乾燥す ると、7- [2-メトヤシイミノー3-(5-ア ミノー1,24-ナアジアゾールー3-イル) アミドリー3-(1-メルホナトメチルー1エ ーテトラゾールー5-イル)テオメチルー3-セ フェム・4-カルボン酸のナトリタム塩(シン異 性体:0.67ド)が得られた。mp 205~210 で(分解)。

> I.R.(x\*\*=~\*):3350, 3250, 1780, 1680, 1530cm<sup>-1</sup>

H.H.R.(d,-DMSO, #): 3.63 (2H, broad a), 2.88 (3H, s), 4.27 and 4.33 (2H, ABq, J-14Hs), 4.98 (2H, s), 5.07 (1H, d, J-4Hs), 5.77 (1H, dd, J-4 \$26 6Hs), 9.85 (1H, d, J-8Hs) 赛施例20

7-12-114-12-15-72/ -1.24-ナアジアソール-3-イル)アキトア ミド]セファロスポラン酸(シン異性体: 3.5 g ) . ( 5 - XN7 / F - 1 E - F > 7 / - N - 1 ーイル)酢酸2ナトリウム塩(20月)及び炭酸 水索ナトリクム(1.3 g)を pH 6.8 の機能緩衝 雑(150 #) に加えて吹る混合物を70でで3.5 時間批拌した。とれを水浴中で冷却し、酢酸エチ ルと混合した後10多年酸を加えて pH3とした。 水層を分離して酢酸エチルを加え、混合物の PE **ま10%製酸で1とした。酢酸エチル層を硫酸マ** グネシタムで軟備し、富弥敦間した。政技をジェ ナルエーテルで粉束化すると、7- [2-ノトキ シイミノー3ー(5ーアミノー1.24ーチアジア Y-N-3-(N) TELTEF)-3-(1-カルボキシメナルー1 日ーテトラゾールー5ーイ ル)ナオノナルー3ーセフュムー4ーカルボン酸 (シン異性体: 1.68 F)が得られた。 mp 123

~ 125 ℃ (分解)。

1.R.(22,-4):3300, 3200, 1750, 1720, 1680, 1620,

H.M.R.(de-DHSO, #) 1 3.78 (2H, broad a), 3.97 (3H, a), 4.27 \$105 4.50 (2H, Abq, f-13Ha), 5.13 (1H, d, f-4Ha), 5.33 (2H, a), 5.83 (1H, dd, 7-4 \$205 8Ha), 8118 (2H, a), 9.66 (1H, d, 7-8Ha)

実施例21 実施例21 でありと阿伊の方法により、下記の

1.80(xx0-m)-13360, 3250; 1780,

minin. (4]-puso. (3) 1/3/45 (28, m).
3/57 (28] broad m). 3.83 (28, m).
3/57 (4.0-4/5 (24), m). 5/10 (11, m).
5/5 4.0-4/5 (24), 5/10 (28, dd. J-4
3/5 (88)). 8/10 (28, m).
9.50 (18, d. J-88)

5.08 (18, 4, 3-48m), 5.78

I.R. (x%=~\mu); 3350, 3250, 1780,

1880, 1630, 1630cm<sup>-1</sup>

H.M.R. (d,-DMSO, \$): 2.02 (2H,
quintet, 7-7Hn), 3.17 (3R,
a): 3.30 (2H, t, 7-7He),
3.67 (2H, broad m), 3.90

(3H, e), 4.32 (2H, t, 7-7Hn),
4.35 (2H, broad m), 5.10

(1H, d, 7-4Hn), 5.80 (1H, dd,
7-4 \$\text{LUS Res}, 8.13 (2H, e),
9.57 (1H, d, 7-8Hn)

7- [ 2-ノトキシイミノー 2- ( 5-7

特閣 昭55- 11600(88) ミノー1.2.4ーチアジアゾールー3 ーイル)アセトアミド ] ー3 ー(3 ーメテルー1,2.4ーチアジ アソールー5 ーイル)チオメチルー3 ーセフェム ー4ーカルボン酸(シン具性体)、np 178 ~ 182 ℃(分解)。

1.R.(メジェール): 3350, 3250, 1780,
1880, 1630, 1530cm<sup>-1</sup>
H.M.R.(d<sub>e</sub>-DMBO, 8): 2.88 (3H, e),
3.60 and 3.77 (2H, ABq, J-17Hs),
3.97 (3K, e), 4.30 and 4.63
(2H, ABq, J-14Hs), 5.17 (1H,
d, J-4Hs), 5.85 (1H, dd, J-4
シービ SHs), 8.13 (2H, e),
9.57 (1H, d, J-8Hs)

(6) アー(2ーメトヤレイミノー2ー(5ーア ミノー124ーチアジアソールー2ーイル)アセ トアミド)ー3ー(5ーメトキレノナルー1,84 ーチアジアゾールー2ーイル)チオメチルー3ー セフェムー4ーカルが少数(レン興性体)、ap 170~174七(分解)。

I.R.(XP=-W): 3350, 3250, 1780,
1680, 1530, 1530 cm<sup>-1</sup>
H.M.R.(d<sub>4</sub>-DM80, d): 3.40 (3R, e),
3.70 (2H, broad e), 3.93 (3H,
e), 4.27 ± LU 4.70 (2E, Abq,
J=13He), 4.82 (2R, e), 5.17
(1H, d, J=4He), 5.83 (1H, dd,
J=4 ± LU 8He), 8.12 (2H, e),
9.57 (1H, d, J=8He)

(6) アー ( 2 - メトキレイ ミノー 2 - ( 8 - ア ミノー 1,24 - チアジア ブールー 2 - イル ) アセ トアミド ) - 3 - ( 5 - メチルナ ホメナル - 1,2,4 - ナアジア ブールー 2 - イル ) チェメチルー 3 セフェムー 4 - カルボン酸 ( シン英世体 ) 、mp 173 ~ 175 で ( 分解 ) 。

I.R.(X2m-4):3350,.3250,.1780,

1680,.1630,.1630.m<sup>-1</sup>

H.M.R.(0,-DMS0, \$): 2.13: (3H, s),

3.70 (2H, bread s), 3.97 (3H,
s), 4.17 (2H, s), 4.27, 4.57

(2H, ABQ, J-14HE), 5.17 (1H, d, J-4HE), 5.85 (1H, dd, J-4, 8HE), 8.15 (2H, e), 9.58 (1H, d, J-8HE)

(7) アー【2ーメトキシイミノー3ー(5ーア・ミノー1.2.4ーチアジアゾールー3ーイル)アセトアミド ] ー3ー(4ープロビルー4 E - 1.2.4ートリアソールー3ーイル)チオメチルー3ーセフェムー4ーカルボン酸(シン典性体)、mp 182~184 で(分称)。

I.R.(\$2\*e-A\*):3350, 3280, 1780,

1080, 1620, 1630 cm<sup>-1</sup>

H.M.R.(4-DM80, \*): 0.83 (3H, t),

7-7Hs), 1.72 (2H, m), 3.67

(2H, broad \*), 3.90 (2H, t),

7-7Hs), 3.93 (3H, s), 4.20

(2H, broad \*), 5.10 (1H; d,

3-6Hs), 5.80 (1H, dd, 7-64;

8Hs), 8.12 (2H, s), 8.63

\$650 6255-- 1160a/#C)

(8) 7-(8-ノトヤレイミノー2-(8-ア ミノー 1.2.4ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(1ーノナルナオノナルー1ミ ーナトラソールー8ーイル) ナオノナルー3ーセ フェムー4ーカルボン酸(セン美性体)、mp 175~178セ(分解)。

I.R. (XP=~N):3850, 3850, 1780, 1880, 1680, 1680, 1680, 1680, 1890,—1 H.M.R. (d\_-DM80, 8): 2.17 (3H, s), 3.72 (2H, broad s), 3.03 (3H, s), 4.30, 4.50 (2H, ABq, 7m-13Hs), 5.13 (1H, d, 7-4Hs), 5.53 (2H, s), 5.53 (2H, s), 8.12 (2H, s), 9.57 (1H, d, 7-8Hs)

(9) 7-(2ーメトキシイミノー2-(5一ア ミノー1.24ーチアジテゾールー3ーイル)アセ トアミド)-3-(1-イソプロビルー1 E-テ トアソールー5-イル)チオメチルー3-セフェ ムー4-カルポン酸(シン異性体)、ng 180

> (SH, e), 4.27 (SH, broad e), 4.33 (SH, broad e), 5.10 (IH, d, 7-4Hm), 8.80 (IH) dd, 7-4, 8Hm), 8.07 (SH, e), 9.53 (IH, d, 7-8Hm)

10 〒- ( 3 - ノトヤシイミノー: - ( 3 - アミノ- 1, 2 4 - チアジアゾールー: 3 - イル) アモトアミド ) - 3 - ( 5 - ( 3 - ビリアン・レー: 5 - ビリアン・レー: 5 - ビリアン・レー: 5 - ビリアン・レー: 5 - イル) ナオメチルー: 3 - セフェムー4 - カルボン酸 ( シン具性体)、ap 175~180 モ( 分祭 )。

I.R.(XP=-N):3350, 3250, 1780,

1680, 1630, 1530 cm<sup>-1</sup>

H.M.R.(G<sub>4</sub>-DMS0, 8): 3.20 (2H. 4,

J=5Hs), 3.67 (2H, broad e),

S.73 (2H, 4, J=5Hs), 3.88

(3H, b), 4.27, 4.57 (2H, ANG,

J=13Hs), 5.17 (1H, %i) J=4Hs),

S.83 (1H,dd, J=4, BHs), 8.13

(2H, a), 9.58 (1H, d, J=8Hs)

~182℃(分解)。

I.R.(ヌジョール): 8350, 3250, 1780, 1680, 1680, 1530 cm -1

H.M.R.(d<sub>4</sub>-DM60, \*): 1.48 (6H, d<sub>4</sub>, J-6H<sub>B</sub>), 3.70 (2H, broad e), 3.93 (3H, e), 4.43 (2H, broad e), 4.75 (1H, m), 6.13 (1H, d<sub>4</sub>, J-4H<sub>B</sub>), 5.82 (1H, d<sub>4</sub>, J-4H<sub>B</sub>), 5.12 (2H, d<sub>4</sub>, J-6H<sub>B</sub>), 8.12 (2H, e), 9.57 (1H, d<sub>4</sub>, J-6H<sub>B</sub>)

I.R.(エジェール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1625, 1530 cm <sup>-1</sup> E.M.R.(d<sub>a</sub>-DMSO, き): 3.67 (2H, broad

s), 3.73 (2H, broad s), 3.96

-

脚 7-{2-メトキシイミノー2-(5-アミノー1,2,4-チアジナゾールー3-イル)アセトアミド)-3-(5-プロピルー1,3,4-チアジアゾール-2-イル)テオノチル-3-セフュム-4-カルがン数(シン異性体)、mp 177~150で(分別)。

I.B.( $EP_{m}-A$ ): 3350, 3250, 1780, 1680, 1630, 1830cm<sup>-1</sup>

H.H.R.(d<sub>a</sub>-DMSD, A) : 0.97 (3H, 4, -78in), 1.73 (2H, m), 3.07 (2H, 4, J-7Hn), 3.70 (2H, 5), 3.97 (3H, a), 4.37, 4.57 (2H, ADq, J-13Hn), 5.17 (1H, d, J-4Hn), 5.83 (1H, dd, J-4, SHn), 8.13 (2H, c), 9.57 (1H, d, J-8Hn)

(株 7-(2-メトキシイミノー2-(5-アミノー1,2,4-チアジアソール-3-イル) アセトフミド)-3-(5-ヒドロキシメナル-1,3,4-チアジアゾール-2-イル) チオメナルー3

ーセフェムー4ーカルボン酸(シン異性体)、 mp 165~170℃(分解)。

I.H.(A5'---'):3550, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530cm<sup>-1</sup>
H.M.R.(4a-DM80, 8): 3.67 (2H, broad a), 2.52 (3H, a), 4.27, 4.57 (2H, ABq, J-13Ha), 4.62 (2H, a), 5.13 (1H, d, J-4Ha), 5.63 (1H, dd, J-4, SHa), 5.17 (2H, a), 9.60 (1H, d, J-8Ha)

64 7-(2-メトキシイミン-2-(5-ア ミノ-1.54-ナアジアソール-3-イル)アセ アミド)-3-(5-メタンスルホンアミドメ チルー1.54-ナアジアソール-2-イル)チャ メチルー3-セフェム-4-カルボン酸(シン異 佳休)、mp 170~175セ(分解)。

I.R.(スジョール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530 cm<sup>-1</sup> M.M.R.(d<sub>0</sub>-DMSO, か): 3.00 (3H, m),

3.67 (2H, broad s), 3,93(8H, s),

(1H, dd, J=4, 8Hs), 8.12 (2H, e), 9.58 (1H, d, J=8Hs)

到 アー [ ネーメトキンイミノーネー ( ネーア ミノー 1, 2, 4 ーチアジアゾールー 3 ーイル ) アセ トアミド ] ー3 ー ( 5 ーメンルメーチルー 1, 3, 4 ー チアジアゾールー 2 ーイル ) テオメテルー 3 ーセ アムム 4 ーカルボン酸 (ン異性体)、mp 175~180 で (分称)。

5 ~ 180 °C (2787) 9
1. (1.4 (24° ~ 24°) 13350, 1250, 1780, 1680, 1620, 1530 

H. K. H. (4, ~ 240° 0, 8) : 8.18 (28, 8), 3.70 (28, 50° 4, 8), 3.93 (38, 38), 4.18, 4.63 (28, 48), 3.93 (18, 48, 48), 3.93 (

9.58 (IH, 4, 7-8He)

37 7-[3-7+キャイミノー3-(5-7)

17-1,24-ナアジアゾール-3-4ル)アセ

トプミド)-3-(4-メテル-4H-1,24-

特別 配合5- 1160g(60) 4.27, 4.53 (28, 48q, 3-14Hp), 4.55 (22, 4, 3-68n), 5.13 (18, 4, 3-4Hp), 5.80 (18, 44, 3-64, 8Hp), 8.03 (18, 4, 3-6Hp), 8.10 (28, 0), 9.53 (18, 4, 3-8Hp), 3-8Hp)

14 7-(2-メトキシイミノー2-(5-ア ミノー1:24-チアジアソールー3-イル)アセ トアミド 3-3-(3-アリルチオー1:24-チ アジアソールー5-イル)チオメチルー3-セァ エム-4-カルボン酸(シン異性体)、mp 170 ~173で(分解)。

I.R.(RP=-4):3350, 3250, 1780, 1680, 1680, 1680, 1830, an-1

B.M.R.(d4-DMSO, #): 3.58, 3.74 (2M, ABq, F-17Re), 2.90 (3M, d, 7-6Me), 3.92 (3M, e), 4.32, 4.54 (2M, ABq, F-14Me), 5.15 (1M, d, 7-4Me), 5.0-5.4 (2M, e), 5.7-6.1 (1M, e), 5.84

トリアゾールー3ーイル)チオメチルー3ーセフ ェムー4ーカルボン酸(シン異性体)、mp 180 マ185 5 (分解)。

I.R. (RFs-Mc):3380, 3250, 1780,

1680, 1620, 1630cs-1

F.M.B. (ds-DMSO, #): 3.83 (2H, e),

3.62 (2H, broad e), 8.87 (3H,

e), 4.08 (2H, broad e), 5.75 (3H,

dd. J-4Hn), 5.75 (3H, dd.

J-4, 3Hn), 8.08 (2H, e), 6.52

(3H, s), 8.50 (3H, e), 6.52

H.M.E.(4,-DMSO, 8): \$.47 (6H, n),
3.0-3.3 (2H, m), 3.07 (2H,
broad n), 3.00 (2H, n),
4.28 (2H, broad n), 4.4-4.7
(2H, m), 5.08 (1H, d, J-4Hn),
5.77 (1H, dd, J-4, 8Hn),
8.12 (2H, n), 9.55 (1H, d, J-8Hn)

間 7- (3-メトキシイミノ-2-(5<sup>2</sup>-ア ミノ-1,24-チアジアゾ-ルー3-イル)アセトアミド)-3-(4-1)アゾ-ルー3-イル)ア )-4Ξ-1,24-トリアゾ-ルー3-イル)テ オメチル-3-キアェム-4-カルボン酸(シン 最性体)、mp<sup>-1</sup>175<sup>2</sup>-180で(分解)。 1.3.(322-ル):3356) 3250, 1780,

I.R. (M; 2m - M): 3350, 3250, 1780, 1780, 1880, 1820, 1830 cm - 1 1880, 1820, 1830 cm - 1 1.87, (2H, m), 3.28 (3H, m), 3.35 (2H, t, J-8Hs), 5.73 (2H, t) road e), 3.97 (3H, e), 4.03 (2H, t, t)

ミノー L S 4 ーチアジアソール 一3 ーイル ) アセトアミド ] ー3 ー ( 5 ーアミノメチルー L S 4 ーチアジアソール ー 2 ーイル ) テオノチルー ニーセフェムー 4 ーカルポン酸 (シン男性体)、 mp 210 ~ 215 ℃ (分解)。

I.R.(x25-2):3350, 3200, 1770,

2080、1680cm<sup>-1</sup>
20 7 - (2-メトキレイミノー2-(5-ア
ミノー1、24ーチアジアゾールー3ーイル)アセトアミドリー3ー(.1-(3-ブミノエチル)1 エーテトナゾールー5ーイル)デオノチルー3
- セフェムー4ーカルボン酸(シン具性体)、エア
300~205℃(分解)。

I.R.(スジュール): 3250, 3200, 1775, 1670, 1620, 1530cm<sup>-1</sup>

関 7-(3-エドキシイミノー3-(5-デ ミノー1,2,4 デナリアダール-3-イル)アセ トアミド) - 3-「(1,3,4 - サアヴァソール-3 -イル) チオブテルー3 - セフェム-4-カルボ ン数(シン異性体)、mp 150 ~ 158 セ (分 特局 昭55- 1160g(j/) J=8Ha), 4.23 (2至, broad e), 5.17 (1E, d, J-6Ha), 5.83 (1E, dd, J-4, 8Ha), 5.15 (2E, e), 5.67 (1E, e), 9.57 (1E, d, J-8Ha)

脚 T-(2-メトキレイミソー2-(5 m ア ミノー1.24 m テアヴァソールー3ーイル)アモ トアミド)-3-(5 m (2 m アミノエチル)-1.3.4 m チアジアソールー2-イル)テオメチル -3-セフェムー3-カルボン酸(レン具性体), 当p 265~210~(分解)。

I.R.(スジョール): 3200, 1770, 1670, 1620, 1530 cm <sup>-1</sup>

20 7-[3-アトキシイミノーユー(5-ア

無)。

۰ .

I.R.(ヌジェール):3350, 3230, 1775, 1680, 1620, 1530 cm<sup>-1</sup>

BM 7-[2-4ソプロポキシ4ミノ-2-( 8-ブミノ-1,24-チアジアゾール-3-4ル ) ブセトブミド )-3-(1,34-ナアジアゾールー3-4ル ルー2-4ル) ナオノチル-3-セフェム-4-カルボン酸 (シン真性体)、mp145~150℃ (分解)。

I.R.(スショール): 3370, 3280, 1780, 1680, 1625, 1530cm<sup>-1</sup>

脚 7 - (2 - プロポキシイミノー 3 - (5 - アミノー 1.3.4 - ナアジアソール - 3 - イル) アセトアミド | -3 - (1.3.4 - ナアジアソール - 2 - イル) ナオノナル - 3 - セフェム - 4 - カルが数(シン異性体)、mp130~133 で(分析)。

1.A.(スシャール): 3380, 3230, 1780, 1680, 1628, 1530 cm<sup>-1</sup> 23 7 - [2-メトキシイミノー2-(5-Z

特別 1855— 1 1 60 n (47

ミノー1,24ーサアジアソールー3ーイル)アセトアミドリー3ー [5-(8-第3数プトキレカルボニルアミノ)メテルー1,3,4ーチアジアソールー3ーイル)テオメテルー3ーセフェムー4ーカルボン酸(レン異性体)、mp 150~155℃(分解)。

I.R.(タジョール): 3350, 3250, 1780, 1670cm<sup>-1</sup>

I.R.(メジェール): 3350, 3250, 1780, 1680, 1620cm<sup>-1</sup>

関 7-[2-メトキシイミノ-2-(5-アミノ-1,3,4ーチアジアソール-3-イル)アセトアミド]-3-アセチルチオメチル-3-セフェム-4-カルボン酸(シン異性体)、mp178

(1H, m), 8.13 (2H, broad m), 9.53 (1H, d, J=8.0Hm)

図 7-(3-エトヤシイミノー3-(5-ア ミノー,24-ナアジアソール-3-イル) アセトアミド,1-3-(1-(3-代3数プト ヤシカルボニルアミノ) エチル) - 1 E-テトラ ソール・5-イル) チオメチルー3-セフュムー 4-カルポン酸(シン異性体)。

I.R.(スジョール):3360, 3240, 1780, 1690, 1630, 1530

1375, 1350, 1170,

N.M.R.(d,-DMSO, 8): 1.27 (SH, 4, J=7H=), 1.33 (SH, m), 3.17-4.0 (GH, m), 4.01-4.5 (4H, m), 5.17 (1H, d, J=4.5Hm), 6.87 (1H, dd, J=4.5, 8.0Hm), 7.0 (1H, m), 8.16 (2H, broad m), 9.57 (1H, d, J=8.0Hm)

80 7-[2-エトキシイミノー2-(5-ア

~182℃(分解)。

I.R.(x2,-1):3350, 3250, 1780, 1680. 1620 == -1

明 7-(3-エトキシイミノー2-(5-アミノー1,24-ナアジアソールー3-イル)アセトアミドリー3-[1-(3-(3-第3数プトキシカルボニルアミノ)プロビル}-18-チトラソールー5-イル}ナオメチルー3-セフェムー4-カルボン酸(シン具性体)、mp 183~188で(分解)。

1.R,(メジョール): 3370, 3340, 1780, 1590, 1630, 1830, 1380, 1260, 1170, 1040 m<sup>-1</sup>

H.M.R.(d,-DMSO, 8): 1.27 (3H, t, J-7Hs), 1.38 (9H, s), 2.0 (2H, s), 2.98 (2H, s), 5.7 (2H, s), 4.0-4.42 (8H, s), 5.17 (1H, d, J-4.5Hg), 5.83 (1H, dd, J-4.5, 8.0Hs), 6.98

ミノー 1,24ーチアジアソールー 3ーイル)アセトブミド ] ー 3ー(1ーメチルー 1 E-Fトタソールー 5ーイル)チオメチルー 3ーセフェムー 4 ーカルボン酸(レン高性外)、コリ 1 5 6~1 5 9 セ(分解)。

I.R.(x2=-\(\nu\):3350, 3250, 1750,

1680, 1625, 1380,

1080, 1040mm<sup>-1</sup>

H.M.R.(d<sub>s</sub>-DMSO, \$):1.27 (3H, t, 7-7Hz), 3.7 (2H, broad e), 3.85 (3E, e), 4.0-4.56 (4H, m), 5.15 (1H, d, 7-4.5, 8Hz), 5.83 (1H, ds, 7-4.5, 8Hz), 6.12 (2H, broad e), 9.53 (1H, d, 7-8.0E)

(レン異性体)、mp 177 ~ 180 ℃ (分解)。
I.R.(メジョール):13380, 3250, 1778,
1870, 1820, 1835,
1380, 1040 cm<sup>-1</sup>

F.M.R.(4-DMSO, 9): 1.27 (3K, t,
7-7Hs), 8.50 (6H, s), 3.17
(3K, s), 3.67 (2K, s), 4.22
(2K, q, 7-7Hs), 4.0-4.7 (4K,
m), 5.12 (1H, d, J=4.5Hs),
5.83 (1H, dd, J=4.5, 8.0Hs),

8.17 (2H, broat s), 9.58

4

図 7-(2-エトヤシイミノー2-(5-アミノー1,24-サアジアソールー3-4ル)アセトプミド )-3-(1-アリルー1 エーチトラソールー5-4ル)テオノナルー3-セフェムー4ーカルがン酸(レン具性体)、mp 160~168で(分解)。

(1H, d, J-8.0Hm)

I.R.(スシェール): 3380, 3250, 1780, 1680, 1630, 1530,

> J=9Hs), 8.12 (2H, broad e), 8.56 (1H, d, J=9Hs), 9.63 (1H, d, J=8Hs)

脚 7- [ 2-エトキレイミノーミー( 5-ア ミノー1、24ーチアジアソールー3ーイル) アセ トアミド ] ー3ー( 5-アミノメナルー1、34ー ナプジアソールー2-イル) チオメチルー3ーセ フェムー4ーカルボン酸(シン具性体)、mp 198~205セ(分解)。

I.R.(メジェール): 3350, 3250, 1775, 1880, 1620, 1535, 1380, 1040 cm <sup>-1</sup>

#.W.R.(d-DMSO+D<sub>0</sub>O, #):1.27(3H, %, J=7Hs), 3.6 (2H, broad s), 4.23 (2H, q, J=7Hs), 4.0-4.83 (4H, s), 5.13 (1H, d, J=4.6Hs), 5.80 (1H, d, J=4.5Hs)

図 7-[2-エトキシイミノ-2-(5-T ミノ-1,8,4-チアジアソール-3-イル) アセ トアミド) -3-(1-(3-ヒドロキシエチル) 特別 昭55— 11600(63) 1380, 1040cm<sup>-1</sup>

H.M.R.(d<sub>a</sub>-DMSO, \$) : 1.25 (3H, t, \$\delta\$
=7Hs), 3.7 (2H, m), 4.0-6.0
(13H, m), 8.13 (2H, broad m),
0.57 (1H, d. \$\delta\$-8.04m)

DB、7-(3-エトキシイミノー3-(5-ア ミノー 3.3.4-チアジアゾールー3-4ル)プセ トアミド ) -3-(テトラソロ (3.5-セ)ピリ ダジンー6-イル)テオメテルー3-セフュムー 4-カルビン酸 (テス男性化)、np 180~ 185で(多報)。

> I.R.(メジェール): 3350, 3240, 1780, 1680, 1620, 1530, 1380, 1040 cm -1

H.H.R.(4,-DMSO, 4): 1.27 (SH, 4, y-7HE), 3.77 (SH, m), 4.20 (2H, q, y-7HE), 4.20, 4.87 (2H, ARQ, J-12HE), 5.20 (1H, d, y-4.5HE), 5.83 (1H, dd, y-4.5, SHE), 7.73 (1H, 4,

ー13-テトクソールー5-イル ] チオメチルー 3-セフュムー4-カルボン酸(シン異性体)、 np 174~173で(分解)。

i.e.(メジェール): 3350, 3240, 1780, 1675, 1625, 1530, 1380, 1040, 720cm<sup>-1</sup>

I.R.(x2,-2):3350, 3250, 1780, 1680, 1625, 1530cm<sup>-1</sup>

粉票 駅55- 11800(64) 7-[2-11+2121-2-(5-7

H.M.R. (4. "DWRO. #) 1 2 8.67 (2H. hroad a) 3.93 (3m, e) 4.20 (2m, broad s), 4.43-4.66 (2H, m), 4.88-5.40 (3H. m) 5.60-6.06 (28. 6). 8.18 (28. d). 8.63 (1H. a), 9.67 (1H, d, J-8Ha) 図 ブードネーメトキシズミノーネー(カーナ ミノー1.24ーチアジナゾールー3ーイルトナモ トナミドリー3ー(3ーノトギシガルボニルー1 2.4ーチアジアゾールー5ニイル)チオグチルー 3ーセフェムー4ーカルポン酸(シン美性体)。 mp 180~185 t (分解)。

1817 2000

123

I.H. (85 m-N): \$350. 2250. 1780. 1740, 1680, 1620. 1530-2-1

N.M.R. (de-DMSO. #): 3.70 (28. hroad e), 3.93 (6H. e), 4.47 (2H. broad e), 5.17 (1H. d. J=4He). 5.83 (18. dd. Jed. 8He) 8.10 (2H. 6), 9.87 (1H. d. J-8Ha)

3/-1.24-チアジアゾール-3-イル)アセ トアミド 1 - 3 - ( 8 - カルポキシー 1, 2, 4 - チ アジアゾールー5ーイル ) チオメチルー3ーセフ ェムー 4 ーカルボン酸 (シン異性体)、 mp 1 7 5 ~180 C (44). I.R. (RD=-N): 3350, 3250, 1780,

1730, 1680, 1680 1530 cm -1

H.M.R.(d.~DHSO, 8) : 3.73 (2H.broad 8), 3,93 (3H. a), 4,47 (9H broad e), 5.17 (1H. d. 7-4Ha). 5.83 (1H, dd, J-4, SHz), 8.10 (2H. s), 9.57 (1H. d. J-8Hm) 7-[2-エトキシイミノー2-(5-ア

ミノー1,2,4ーチアジアソールー3ーイル)アセ FTEF]-8-(1-(8-78/70KM)-I Rーテトラゾールー 5 ーイル ] ーチオメチルー 3ーセフェムー4ーカルボン酸(シン異性体)。 mp 182~185℃(分解)。

'I.R.(メジョール):3350, 3200, 1770. 1670, 1620, 1830,

. 1380. 1040 cm -1 - . . WD 7-12-11-2-15-7 ミノー1.24ーナアジアゾールー3ーイル)アセ トアミドリー8ー(1ー(2ーアミノエチル)ー 18-テトラゾールー5-イル ] ナオメナルー3 ーセフェムーもーカルポン酸(シン異性体)、RD 195~210℃(分解)。

I.R. (x0,-1):3340, 8210, 1770, 1675. 1620. 1530.

1380 . 1040 cm -1

(4) 7- [ 3-イソプロポキシイミノー 2-( 5ーナミノー 1,2,4ーチナジナゾールー3ーイル )アセトアミドリー3ー(1ーカルボキシメチル -18-チトラゾールー5-イル)ナオメチルー 3ーセフェムー(ーカルボン酸(シン異性体)。 пр 176~180 С (分解)。

I.R.(RD+-N): 3300, 3200, 1770, 1720, 1680, 1620,

1520 cm -1 H.M.R.(4.-DMSO, 8) : 1.27 (6H, 4, 3 -6Hs), 3.67 (2H, broad s). 4.23 46 4.47 (2H, ABQ, J=14Hs). 4.20-4.50 (IR,m), 5.10 (IR, 4 T-4Hz). 5.30 (2H, e), 5.80 (1H. dd. J-4, 8Hs), 8.10 (2H, a). 9.47 (18. d. J-88s)

44 7-[2-1]+++43/-2-(5-T ミノー 1.24ーチアジアソールー 3 ーイル ) アセ トナミドリーオー(5ーカルボキシメチルチオー 1. 3. 4 - + T = T Y - N - 2 - 1 N ) + \* \* + N - 3 - セフェムー 4 - カルポン酸 (シン異性体 )、 mp 150~158℃(分解)。

I.R. (x3 -4): 3350, 3250, 1780. 1720, 1680, 1620. 1530 cm ~ 1

H.R. (4-DHSO. 4) : 3.60 and 2.72 (2B. ABq. J-18Es), 3.92 (3E, e), 4.14 (2E, e), 4.22 and

4.48 (2E, ABq, J-14Hs), 5.12 (1E, d, J-4Hs), 5.80 (1E, dd, J-4, 8Hs), 8.80 (2E, s) 9.50 (1E, d, J-8Hs)

46 1-[3-4ソプロポキシ43/-3-( 8-アミノー1,2,4-チアジアゾールー3-4ル ) アキトアミド ]-3-(1-/チルー1ヨーテ トラゾールー5-(ル) チオメチルー3-セフェ ムー4-カルボン酸(シン異性体)、mp 170 ~175で(分解)。

I.B.(\(\mu^2\nu^{-4}\):3380, 3250, 1780, 1680, 1620, 1530cm^{-1}

H.M.B.(4;-DMBO, \(\delta\)): 1.27 (6E, d, J-6Hs), 3.73 (2E, broad e), 4.00 (3H, e), 4.33 (2E, broad e), 4.27-4.67 (1E, m), 5.17 (1E, d, J-4\(\mu\)): 8.15 (2E, e), 9, 8.3 (1E, d, J-8Hs).

畑 7-[3-インプロポキシイミノー3-(

165~170 t (分類)。
I.R.(水ジェール):3300, 3300, 1778。
1710, 1670, 1628。
1825æ<sup>-1</sup>

H.H.E.(d,-DMSO, 8): 1.83 (8H, 4, 3-6Hs), 3.75 (2R, broad s), 4.20-4.50 (1H, m), 4.28, 4.68 (2H, Abq, 3-18Hs), 5.18 (1H, 4, 3-8Hs), 5.87 (1H, 4d, 3-5, 6Hs), 7.76 (1H, 4, 3-10Hs), 8.83 (1H, 4, 3-10Hs), 9.63 (1H, 2, 3-6Hs), 7.76 (2-4/2/2/4/4/2/2/2-2-(

5 - アミノー 1,3 4 - ナアジアソールー 3 - イル ) アゼトアミド ] - 3 - (1 - アリルー 1 1 - テ トクソールー 5 - イル ) ナオノテルー 3 - セフュ ムー 4 - カルボン酸 (シン属性体)、 mp 155 ムー 140で (分解)。

I.R.(x>,-\nu):3350, 3230, 1780, 1680, 1626, 1530cm<sup>-1</sup> 特勝 昭弘 - 1180g(45)
5 - アミノー1、2、4 - チアジアゾールー3 - イル
) アセトアミド | 3 - 「 1 - 「 2 - ( 3 - 第 3 級プトキレカルボニルアミノ ) エチル | - 1 里 - テトラソール - 5 - イル ) チオノチル - 3 - セフ ェムー 4 - カルボン酸 ( シン具性体 )、 = p 1 4 2 ~ 1 4 7 セ ( 分解 )。

I.R.(RUp-N): 3350, 3250, 1780,
1690, 1630, 1530cm<sup>-1</sup>
H.M.R.(da-DMSO, #): 1.22 (6H, d,
7-6HE), 1.30 (9H, e), 3.173.50 (2H, m), 3.70 (2H, broad
e), 4.17-4.67 (5H, m), 5.13
(1H, d, 7-4HE), 5.83 (1H, dd,
7-4, 8He), 8.17 (2H, e),
9.55 (1H, d, 7-8HE)

明 7-(2-4ソプロポキシイミノー2-(6-アミノー124-テアジフソールー3-4ル) アセトアミド) - 3-(チトラソロ 1.5-カ) ピリダシー6-4ル) テオノテルー3-セ フェムー4-カルポン酸(シン異性件)、mp

59

H.N.R.(d,-DMSO, \$): 1.27 (6H, d, J -6Hh), 3.88 (2H, broad h), 4.25, 4.45 (2H, Abq, J-13Hh), 4.20-4.80 (1H, m), 4.85-6.08 (2H, m), 5.13 (1H, d, J-5Hh), 5.18-5.46 (2H, m), 8.62 (1H, dd, J-5, \$Hh), 5.60-6.20 (1H, m), 8.12 (2H, broad h), 9.48 (1H, d, J-8Hh)

69 プー(2ーメトキシイミノー2ー(8ーア ミノー1,2.4ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミド) - 3ー(5ートリアルモロメチルー 1, 3.4ーチアジアソール - 2ーイル)チオメチルー - 5 - セフェムー4ーカルボン酸(シン興性休)、 mp 150~155 で(分解)。

T.R.(Ry=-A):3300, 3200, 1770, 1670, 1670, 1680, 1580 cm<sup>-1</sup>

#.W.R.(d<sub>4</sub>-DMSO, 3): 3.70 (2H, broad a): 2.93 (3H, s), 4.37, 4.65
(2H, Apq., 7-13HA), 5.17 (1K,

**特別 昭55- 11600(66)** 

8Hs), 8.17 (2H, broad s),
9.37 (1H, d, 7-8Hs)
何 7-[2-メトキレイミノ-2-(5-ア
ミノー1.2.4-チアジアゾールー3-イル)アセトアミド]-3-[2-カルボキシノテルー3-オン-2.3-ジヒドロー1,2.4ートリアソロ[4.3-b]ピリダジン-6-イル)テボメテルー3-セフェム-4-カルボン酸(シン美性体),
10-205-~210で(今報)。

d. J=5He). 8.85 (1H, dd, J=5.

H.M.R.(d<sub>s</sub>-DM80, \$) : 3.67 (2H, broad a), 3.93 (3H, \*), 4.27 (2H, broad a), 4.63 (2H, \*), 5.10 (1H, d. 7-5Ha), 5.75 (1H, dd, 7-5, 8Ha), 7.05 (1H, d. 7-10Ha), 7.67 (1H, d. 7-10Ha), 8.13 (2H, broad \*), 9.58 (1H, d. 7-8Ha) 図 7-[3-パトキレイミノー2-(5-ア ミノ-1,24-チアジアゾールー3-イル)アセ トアミド]-3-(5-パチルアミノー1,34-デジアゾールー2-イル)チオパチルー3-セ フェムー4-カルボン酸(レン興性体)、mp 175~180で(分解)。

80 7- [2-メトキシイミノ-2-(5-ア ミノー1,2,4-チアジアソール-3-イル) アセ トアミド] -3-(5-アミノ-1,3,4-チアジ

,

アゾールー3ーイル)チオノチルー3ーセフュム ー4ータルボン酸(シン科性体)、mp 165~ 170℃(分解)。

I.R. (\$\pi\_{\text{w}}^2 - \pi\_{\text{s}}\); 3350, 3210, 1770, 1670, 1620, 1520cm^1

H.H.R. (d\_-DHSO, \$\pi\_{\text{s}}^2 \); 3.67 (2H, broad e), 3.95 (3H, a), 4.08, 4.25 (2H, ABq, \$\pi\_{\text{s}}^2 \); 5.18 (1H, d, \$\pi\_{\text{s}}^2 \); 6.18 (1H, dd, \$\pi\_{\text{s}}^2 \); 6.18 (2H, broad e), 8.15 (2H, broad e), 9.57 (2H, d, \$\pi\_{\text{s}}^2 \); 1.38 (2H, broad e), 9.57 (2H, d, \$\pi\_{\text{s}}^2

I.R.(x2=-N): 3370, 3280, 1785,

\*

1690, 1630, 1530 cm<sup>-1</sup>

H.H.R.(d<sub>+</sub>-DM80, \$\rho\$): 1.37 (\$\rho\$H<sub>1</sub> \*),

1.73-2.17 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 2.73-3.17
(\$\rho\$E, m.), 2.68 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*),

3.80 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 4.25 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*),

5.12 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 4.27 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*),

5.12 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 5.80 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*),

4.4 \$\rho\$F=8.88\*), 6.70-7.02 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*),

8.13 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 5.70-7.02 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*),

1.8.13 (\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 5.55
(\$\rho\$H<sub>2</sub> \*), 4.7=88\*)

図 7-(2-/トキシイミノ-3-(5-アミノ-1,24-チアジアゾール-3-4ル)アセトアミド)-3-(1-(3-(アセトアミド)プロビル)-18-チトラゾール-6-4ル)テオノチル-3-セフェムーカルボン酸(シン異性体)、コリ 150~155に(分解)。
1,8,(ア)=ル):3350, 3230, 1730.

1860, 1620, 1530 cm<sup>-1</sup>

H.M.R.(d<sub>4</sub>-DM80, 8): 1.80 (3H, e),

1.87-2.17 (2H, m), 2.90-3.30

### #### #255- 11600(67)

(2H, m), \$.70 (HH, broad s),
3,95 (2H, s), 4.28 (2H, t,
j=7Hs), 4.30 (2H, broad s),
5.13 (1H, d, j=5Hs), 5.82
(1H, dd, j=5, 8Hs), 7.77-8.03
(1H, m), 8,10 (2H, broad s),
6.57 (1H, d, j=8Hs)

BO 7-(2-メトキシイミノー2-(8-ア ミノー1.24-デアジアゾールー3-イル)プセ トアミド)-3-(1-(1-(1-(アセトブミドメ ナル)エテル)-18-テトラソールー3-イル )ナオメチルー3-セフェム-4-カルボン酸( シン異性体)、mp 160~165で(分解)。 I.R.(スジョール):3350, 3250, 1780, 1660, 1620, 1830,m<sup>-1</sup> R.E.R.(43-DESO, 4): 1.62 (8R, 4,

J=6Hs), 1.75 (3H, e), 3.13-3.80 (2H, m), 3.72 (2H, broad a), 3.93 (3H, e), 4.33 (2H, broad e), 4.50-4.83 (1E, m),

2750

8.20 (2H, broad s), 9.72 (1H, d, J=SHs)

10 7-(3-ノトキヤイミノー3-(5-アミノ -1,3.4-ナアジアゾール-3-イル) アセトア ミド ]-3-(1-(3-(5-ジールー5-イル)) アセトア ノ) プロビル ]-1 E-テトラソールー5-イル ]ナオノチル-3-セアュム-4-カルボン酸 ( レン典性体)、mp 165~170℃(分解)。 1.8.(ボジール):3350,3200,1770。

I.E.(xy=-w-):3386, 3200, 1776,

B.H.R.(a,-DHSO, 0):2.03-2.57 (2H, m),

2.67 (6H, m), 2.73-2.27 (2H, m),

3.67 (2H, broad m), 3.93 (3H, m), 4.23 (2H, broad m),

4.10-4.77 (2H, m), 5.05 (1H, d, J=5Hm), 5.70 (1H, dd, J=5, 3Hm), 7.93-8.43 (3H, m),

9.63 (1H, d, J=6Hm)

67 7- { 2-4ソプロポキシイミノー2-(

5-アミノー1,2,4ーチアジアゾールー3ーイル)

5.12 (1H, d, J=5Hm), 5.80 (1H, dd, J=5, 8Hm), 8.00 (1H, t, J=6Hm), 8.10 (2H, broad m), 9.53 (1H, d, J=8Hm)

I.R.(ヌジョール): 3370, 3830, 1780. 1690, 1630, 1530 cm <sup>-1</sup>

N.M.E. (d<sub>s</sub>-DMSO, \$): 1.33 (9H, \*\*),
1.50 (3H, d, 7=6H\*\*), 3.17-3.60
(2H, m), 3.73 (2H, broad \*\*),
3.93 (3H, \*\*), 4.35 (2H, broad \*\*),
4.34 (3H, \*\*), 5.17
(1H, d, 3-5H\*\*), 5.87 (1H, dd,
1=5, 5H\*\*), 6.93-7.23(1H, m),

アセトアミド ) -- 3 -- ( 5 -- ( 5 -- 第3 数プトキ レカルポニルアミノ ) メチルー 1,8,4 -- チアジア ソール -- 2 -- イル ) チオメチルー 3 -- セフェムー 4 -- カルボン歌 ( シン興性体 )、np 140 ~- 145 で ( 分解 )。

1.R.(スジョール): 3300, 1780, 1670, 1620. 1530 cm -1

図 7-(2-メトヤレイミノー2-(5-アミノ-1,24-チアジアゾール-3-イル)アセトアミド)-3-(1-(2-カルポヤシエテル)-1n-テトラゾール-5-イル)チオメテル-3-セフェム-4-アルボン酸(シン美性体)。pp 150~155℃(分解)。

「I.R.(ダジョール): 3300, 3150, 1770, 1720, 1670, 1620, 1520cm<sup>-1</sup>

関 7-(2-メトキシイミノーミー(5-ホ スポノアミノー1,2,4-チアジアソールー3-イ ル)アセトアミド)-3-(1,3,4-チアジアソ ール-2-イル)チオメチル-3-セフェム-4 -カルボン物(シン単作体)。 で(分級)。

I.B.(AD=-N): 3180, 1765, 1670. 1515 cm -1

M 7-[2-11+2/3/-2-(5-7 ミノー 1,2,4ーチア:\*アソールー3ーイル ) アセ トアミドリー3-[1-(3-アミノブロビル) -18-テトラソールー5-イル 1チオメチルー 3ーセフェムー4ーカルポン時(シン基件体)。 mp 186~190 t (44).

I.R.(スジェール): 3300, 3200, 1770. 1670, 1610, 1530 am -1

80 7-12-イソプロポキシイミノー2-( 5-アミノー1,2,4-ナアジアソールー3-4ル ) アセトアミドリー8ー(8ーアミノメチルーL 3.4ーチアジアソールー8ーイル)チオメチルー 3ーセフェムー4ーカルボン酸(シン具性体)、 mp 210~215 C(分解)。

I.R.(スジャール): 3350. 3200. 1750. 1670. 1620, 1530 cm -1

ムー4ーカルボン酸(シン異性体)、 mp 170 ~ 175℃(分級)。

I.R.(XV=-N):3800, 1780, 1680m-1 物 アーしョーメトキシイミノーョー(8-ア ミノー1.2.4ーチアジアソールー3ーイル)アセ トアミドリー3ー(ユーメデルー18ーデトラツ ールー5ーイルナオメナル)ー3ーセフェムー4 カルボン酸(ジン異性体)、mp 170~175 で(分解)。

I.B.(メジャール):3300, 1770, 1660, 1610. 1520 cm -1

80 7-12-11-27-27-27-C5-7 ミノー1.24ーチブジアゾールー3ーイル)アセ トプミドリーヨー(ヨーメナルー 1,3,4ーチアジ アソールーミーイルナオメナル)ーミーセフェム - 4 - カルボン酸(シン異性体)、mp 175~ 180℃(分解)。

I.R. (RD=-N): 3350. 1780, 1680. 1625. 1530 cm -1 80 7-{2-11+21=1-2-(5-7

特期 取55- 11600/601

7- [ 3-1 ソプロポキシイミノー2-( 5ーアミノー1,2,4ーチアジアソールー3ーイル )アセトアミドリー3ー「1ー(2ーアミノエチ ル)ー1 Hーテトラゾールー5 ~ イル ] チオメチ ルー3ーセフェムー4ーカルポン酸(シン具件体)、 ap 195~200℃(分解)。

I.R.( \*\* -- -- ): 3350. 3250. 1775.

1680, 1620, 1530 ap -1 7-12-11-21-2-15-7 ミノー 1, 2, 4 ーナアジアソールー 3 ーイル ) アセ トプミドリー3ー [ 1 ー ( 1 ー ( アミノメチル )エ fn)i Hーチトラソールー5ーイル ] チオメチル - 3 - セフェムー 4 - カルポン酸 (シン異性体)、 mp 190~195 t (分解)。

I.R.(メジョール): 3350, 3230, 1770,

1670. 1620, 1530 am -1 7- [ 2-1 トキシイミノー 2- [ 5-ホ ルムアミドー 1.2.4ーナアジアゾールー 3 ーイル ) T t | T = | | - 3 - ( 1 - 1 + N - 1 H - 9 トラゾールーちーイルナネメチル)ー3ーセフェ

ミノー 1.2.4ーチアジアソールー 3 ーイル)アセ トアミドリーるー(1.3.4ーチアジナソールー 2 ーイルチオメチル) - 3 - セフュム - 4 - カルボ ン酸(シン異性体)、コア 172~177℃ (分 解)。

I.R.(メジョール): 8350, 1775, 1680.

1626. 1530 cm -1 7- [2-メトキシイミノースー(カーナ ミノー1.2.4ーナアジアソールー3ーイル)アセ トプミドリー3-(1-アリル-1ヨーテトラソ ールー5ーイルチオメチル)ー3ーセフェムー4ー カルポン酸(シン異性体)、mp 170~172℃ (分無)。

I.R.(スジョール):3350, 1780, 1680, 1625, 1530 cm -1

# 实施例22

てー[ 3 - メトキシイミノー 2 - ( 5 - アミノ - 1.2.4 - チアジアソールー 3 - イル ) アセトア ミド ) -3-(1-(2-(第一般3級プトキシ カルボニルアミノ ) エチル } ー 1 日 ーテトラゾー

N-5-4N1++4+N-3-47+A-4-カルボン酸(シン具性体:20月)の99多年酸 (20㎡)旅游を容易で2.5時間保持した。混合 物を蒸発範囲し、我接を供験水業ナトリタムの水 放送に強偏した。及いで106塩酸で pB 3に同 称し、新出物を形去した。この記蔵を、非イオン 供吸着機能(ダイヤイオンNP30)(磁線:三 夢化成工機株式会社製)のカラムクロマトグラフ 4 に歴期した。カラムを水洗した後、50%水性 メタノールで飲出した。 終出液からメタノールを 祝夫」、 海動動像すると、7~(8~ノトキシイ ミノー 2 ー ( 5 ー ナミノー 1,2,4 ーチアジアソー N-3-4N)TTIF1-3-[1-(2 - アミノエチル ) - 1 日 - テトラソールー 5 - イ ルーチオメチルー3ーセフェムー4ーカルポン酸 (シン異性体: 250 m)が得られた。 mp 200~205℃(分解)。

I.R.(スジェール): 3350, 3200, 1775, 1670, 1630, 1530cm<sup>-1</sup> H.M.R.(d.-DMSO. #): 3.47 (2E, broad w) 神間 昭35- 1180g(5) 3,60 (2H, broad e), 3.93 (3H, s), 4.2 (2H, broad e), 4.37 (2H, broad e), 4.78 (2H, broad e), 5.03 (1H, d, J-4Hs), 5.70 (1H, dd, J-4, 8Hs), 6.10 (2H, s), 9.50 (1H, d, J-5Hs)

## 实施例 2 3

7-(2-ノトやシイミノーを一(5-アミノー1、24-ナアジアゾールー3-(ル)アセトア
ミド) ー3-(1-(3-(5-16)3 駅プトやレ
カルボニルアミノ)プロビル )-1目-テトラソ
ールー5-イル)チオメチルー3-セフェムー4
- カルボン酸(シン異性体: 2・23 タ)のが酸化
2 2 ㎡) 路級を窓頭で2.5時間 限料した。以前の 会域を特徴化とって鉄地弾すると、アー(2-ノ シアソールー3-イル)アセトアミド)-3-(
1-(3-アミノアロビル)-11-モデトラー3-(
1-(3-アミノアロビル)-11-モデトラソールー3-イル)テオノチルー3-セフェム・4-

瓣

た。 mp 185~190で(分解)。

I.R.(エジェール): 3300, 3200, 1770, 1670, 1610, 1530cm<sup>-1</sup>

10.0, 1010, 10110

H.M.R. (d<sub>e</sub>-DMSO+D<sub>2</sub>O, \$): 2.0-2.33 (2H, m), 2.67-3.0 (2H, m), 3.40-3.70 (2H, m), 3.93 (3H, m), 4.10-4.67 (4H, m),

5.03 (1H, d, J-5Ha), 5.75

(1H, d, T-8Hs)

# **夹施供24**

実施例22及び23と同様の方法により下記の 化合物を製造した。

(1) 7- [2-人トヤンイミノー2-(5-ア ミノー1: ま-ナアジアソテルー3: -イル) アギトアミド 3-3-(5-アミノムテルー1: 3-4-ナアジアソールーミーイル) ナオイナルー3-ギアエムー4-カルギン酸(ビン発生体)。 ap 21.0 ~ 21.5 で (分級)。 エエー(メジョル): 3350, 3290, 1770,

1.H.(x2,-w): 3350, 3200, 1770, 1680, 1620 cm<sup>-1</sup> E, E, (4-DHSO, 3): 3.60 (2H, broad e), 8.93 (3H, e), 4.33, 4.57 (2H, ABq, J=13Hs), 4.43 (2H,

(2H, ABq, J=13Hs), 4.43 (2H, p), 5.10 (1H, d, J=4Hs), 5.77 (1H, dd, J=4, SHs), 8.17 (2H, s), 9.50 (1H, d, J=8Hs)

I.R.(スジョール): 3200, 1770, 1670,

(4)... でごく キーエトキシイミノーヨー(5 ー ア ミノー 3.3.4 ピチアジアゾールーヨーイル) アセ トフミド 3 ーコージ(5 ー ア ミノメテルー 3,4 ー チアジアゾールー 2... イル) チオメチルー 3 ーセ フェムー 4 ー アルボン数(セン美性外) 1 mp 188 ~ 208 セス分解) I.R.(スジェール):3350, 3250, 1775. 1680, 1620, 1535,

1380, 1040m<sup>-1</sup>
(d) 7-(3-エトキレイミノー3-(6-アミノー1.24-チアジアゾールー3-イル)アセトアミド)-3-(1-(3-アミノブロビル)-1-テトラゾールー5-イル)チオメチルー3-セフュム-4-カルボン酸(シン異性体)。
DD 182~155セ(分配)。

I.R.(x22-x):3350, 3200, 1770, 1670, 1620, 1530,

1380, 1040 m<sup>-1</sup>
H.E.R.(4g-DH80, 0): 1.27 (3H, 4, 77Hs), 2.17 (2H, m), 2.83 (2E, m), 4.17 (2H, q, 2-7Hs), 3.7-4.7 (6H, m), 5.00 (1H, d, 3-4.5Ks), 8.17 (2H, broad s), 8.33 (1H, d, 3-8.0Hs), 8.31 (2H, broad s), 8.33 (1H, d, 3-8.0Hs)

(6) 7-[2-エトキシイミノー2-(5-ア

1670, 1620, 1530cm-1
8.M.R.(d<sub>4</sub>-DHSO, 8): 1.30 (6H, d,
7-5Hs), 3.67 (2H, broad s),
4.20-4.33 (6H, s), 5.13 (1H,
d, 7-4Hs), 5.30 (1H, dd, 7-4,
3Hs), 8.13 (2H, s), 9.43 (1H,
d, 7-8Hs)

(f) アー [ 2 - インプロポキシイミソー 2 - で 5 - ブミメー 1.24 - サアジアゾールー 3 - イル ) ブセトアミド ] - 9 - [ 1 - ( 2 - ブミソエチ ル) - 18 - チトラソールー 5 - イル ] チオメデ ル - 3 - セフェムー 4 - カルポン酸 ( シン異性体 ) mp 195 ~ 200 セ( 分解 )。

1.R.(RPs-w):3350, 3250, 1778,

1880, 1820, 1530 m<sup>-1</sup>
H.M.R.(d.-DHSO, 8):11,27 (SH, d.,

J-SHE), 31.47 (SH, broad s),

3.67 (SH, broad s), 4.27

(ZH; broad s), 4.23-4.57

(IH, m), 4.67 (ZH, broad s),

特際 昭55- 11500(70) ミノー 1、3、4 ーナアジアソールー 3 ーイル)アセ トアミドリー 3 ー (1 ー (2 ーアミノエチル) ー 1 エーテトラソールー 5 ーイルリテオメテルー 3 ーセフェムー 4 ーカルがン酸 (シン典性体)、 mp 195~210 セ (分解)。 1.3.(メジャール): 3340, 3210, 1770,

1675, 1620, 1530,
1380, 1040cm<sup>-1</sup>
R.M.R.(d<sub>s</sub>-DMSO+D<sub>s</sub>O, \$) : 1.26 (3M, 4,
3-7Mm), 3.0-3.7 (4M, m), 4.0-

J-7E=), 3.0-3.7 (4H, m), 4.0-4.5 (4H, m), 4.66 (2H, m), 5.03 (1H, d, J-4.5Hm), 8.70 (1H, d, J-4.5Hm)

(6) 7- [ 3-4ソプロポキシイミノー 2-( 5-アミノー1,24-チアジアソールー3-4ル ) アセトアミド ] - 3-(5-アミノメチルー1, 3.4-チアジアソールー2-イル) チオメチルー 3-セフェムー4-カルボン酸(シン異性体)。 pp 210~215で(分解)。

I.R.(スジョール): 3350, 3200, 1750,

5.10 (1H, d, J=4Hs), 5.83 (1H, dd, J=4, 8Hs), 8.17 (2H, e), 9.47 (1H, d, J=8Hs)

(8) 「アー(2ーメトキレイミノー2ー(5ーア ミノー1:スイーチアジアゾールー3ーイル) アセ トアミドリー3ー(1ー(1ー(アミノメナル) エデル) - 1 エーテトラソールー5ーイル) チオ メテルー3ーセデュムー4ーカルボン酸(レン属 性体)、mp 180~195℃(分解)。

1.R.(ロジョール): 3360, 3230, 1770, 1670, 1620, 1530 cm -1

H.H.R.(d<sub>4</sub>-DM80+D<sub>2</sub>O, \$): 1.23-1.70 (3H. m), 3.10-3.80 (4H. m), 3.92 (3H. m), 4.0-4.5 (3H. m), 8.05 (1H. d. J=SHm), 5.73 (1H. d. J=SHm)

(B) 『Tー(2ーメトキシイミノー3ー(6ーテ ミノー124ーチアジアソールー3ーイル)テモ トアミド)ー3ー(5ーアミノー134ーチアジ アソールー8ーイル)チネメチルー3ーセフェム ー 4 ーカルボン酸(シン具性体)、mp 165 ~ 170 ℃(分解)。

1.R.(メジョール): 3350, 3210, 1770, 1670, 1620, 1520cm<sup>-1</sup>

出頃人 摩沢鹿品工業株式会社

出與人 歷代薬品工業株式会社

代現人 弁理士 青 木